

MEDICINAL COMPOSITION

Publication number: JP9221476

Publication date: 1997-08-26

Inventor: OGAWA HIDENORI; KONDO KAZUMI; YAMASHITA HIROSHI; SUGA KEIZO; MATSUZAKI NORIYUKI; SHINOHARA YUICHI; TANADA YOSHIHISA; KURIMURA MUNEAKI; TOMINAGA MICHIAKI; YABUUCHI YOICHI

Applicant: OTSUKA PHARMA CO LTD

Classification:

- international: *C07D243/12; A61K31/55; A61K31/551; A61P9/12; A61P43/00; C07D223/16; C07D243/14; C07D401/06; C07D401/10; C07D401/12; C07D401/14; C07D403/10; C07D403/12; C07D405/12; C07D409/06; C07D413/10; C07D417/06; C07D417/10; C07D471/04; C07D243/00; A61K31/55; A61K31/551; A61P9/00; A61P43/00; C07D223/00; C07D401/00; C07D403/00; C07D405/00; C07D409/00; C07D413/00; C07D417/00; C07D471/00; (IPC1-7): C07D223/16; A61K31/55; C07D243/12; C07D243/14; C07D401/06; C07D401/10; C07D401/12; C07D401/14; C07D403/10; C07D403/12; C07D405/12; C07D409/06; C07D413/10; C07D417/06; C07D417/10; C07D471/04*

- European:

Application number: JP19960354761 19961216

Priority number(s): JP19960354761 19961216; JP19950348123 19951215

[Report a data error here](#)

Abstract of **JP9221476**

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a medicinal composition, comprising a new compound, effectively used as a vasopressin antagonist, a vasopressin agonist, etc., selective according to various therapeutic purposes such as a tablet or a powder and useful as a medicinal preparation. **SOLUTION:** This medicinal composition comprises a benzoheterocyclic derivative represented by formula I [G is a group represented by formula II (R<1> is H, a lower alkyl, etc.; R<2> is H, OH, etc.; R<3> is H or an OH-substituted lower alkyl; X is methylene, a single bond, etc.), etc.; R is adamantylcarbonyl, a cycloalkylcarbonyl, etc.; R<1> is same as that described above] and its salt, e.g. 7-chloro-5-[N-methyl-N-(2-diethylaminoethyl)amino]carbonylmethyl-1-(2-methoxy-4-methoxybenzoyl)-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzazepine hydrochloride. The compound represented by formula I is obtained by carrying out the usual amide bond forming reaction of, e.g. a benzoheterocyclic compound represented by formula III with a carboxylic acid according to, e.g. a mixed acid anhydride method or an active ester method.

.....
Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平9-221476

(43) 公開日 平成9年(1997)8月26日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 223/16			C 0 7 D 223/16	A
A 6 1 K 31/55	ABU		A 6 1 K 31/55	ABU
	AED			AED
C 0 7 D 243/12			C 0 7 D 243/12	
243/14			243/14	
審査請求 未請求 請求項の数 4 F D (全 646 頁) 最終頁に続く				

(21) 出願番号	特願平8-354761	(71) 出願人	000206956 大塚製薬株式会社 東京都千代田区神田司町2丁目9番地
(22) 出願日	平成8年(1996)12月16日	(72) 発明者	小川 英則 徳島県板野郡松茂町中喜来字中瀬西ノ越25番地の18
(31) 優先権主張番号	特願平7-348123	(72) 発明者	近藤 一見 徳島県板野郡松茂町中喜来字稲本55番地の11
(32) 優先日	平7(1995)12月15日	(72) 発明者	山下 博司 東京都文京区湯島4丁目5-11 堀内ビル202号
(33) 優先権主張国	日本 (J P)	(74) 代理人	弁理士 三枝 英二 (外4名) 最終頁に続く

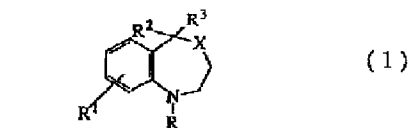
(54) 【発明の名称】 医薬組成物

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 本発明は、バソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤、バソプレシン作動剤等として有用な医薬組成物を提供することを目的とする。

【解決手段】 本発明の医薬組成物中に含有されるベンゾヘテロ環誘導体は、一般式(1)で代表される化合物である。

し、 R^1 は水素原子、ハロゲン原子等を示し、 R^2 は水素原子等を示し、 R^3 は水素原子、 $-\text{CH}_2\text{COOR}^{15}$ (R^{15} : 水素、低級アルキル基等)等を示し、 R は式(2)、式(3)等の基を示す]

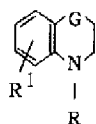


[式中、 $\text{X}^{12}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-\text{CH}-$, $-\text{NR}^{14}$ (R^{14} : 水素原子、低級アルキル基等)または単結合を示す]

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式

【化1】



〔式中Gは

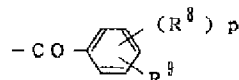
【化2】



を示す。R¹は水素原子、又はハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。R²は、基-NR⁴R⁵（R⁴及びR⁵は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。）；水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基；カルボキシ基置換低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；又は基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷（m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であってはならない。Aは低級アルキレン基を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶及びR⁷は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）を示す。R³は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。またR²とR³とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級

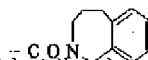
アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基；シクロアルキルカルボニル基又は基

【化3】



（pは1又は2を示す。R⁸は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹は、基-NR¹⁰R¹¹（R¹⁰は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【化4】

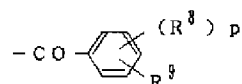


、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル

低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。また R^{10} 及び R^{11} は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。); 水素原子; 低級アルカノイルオキシ基; 低級アルカノイル基; 低級アルコキシ基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基; シクロアルキル基; 低級アルキル基; 低級アルキルチオ基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基; フェノキシ基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基; フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基; ピロリジニル置換低級アルコキシ基; 窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和もしくは不飽和の5~11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有していてもよい); シクロアルケニル基; フェニル低級アルキルアミノカルボニル基; 置換基として低級アルキル基を有する

ことのあるアミノスルホニルオキシ基; シアノ基; 又は基-(A) $m-CHR^{12}R^{13}$ (Aは前記に同じ。 R^{12} は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。 R^{13} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。 mは0又は1を示す。)を示す。 Xはメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR¹⁴- (R^{14} は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。 Yは-NR^A-を示す (R^A は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR^BR^Cを示す。ここで R^B 及び R^C は、同一又は異なつて水素原子又は低級アルキル基を示す。またこの R^B 及び R^C は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。但し、 R^2 が基-NR⁴R⁵ (R^4 及び R^5 が同一又は異なつて、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基-(O) $m-A-(CO)uNR^6R^7$ (mは1、uは0又は1を示す。 R^6 及び R^7 が同一又は異なつて水素原子又は低級アルキル基を示すか、 R^6 及び R^7 がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5~6員環の飽和複素環を形成する(該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい))、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基; 又は R^2 と R^3 が一緒になつてオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する; Rが基

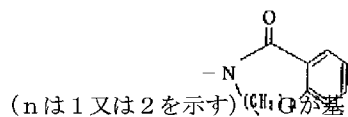
【化5】



であつて、 R^8 が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 R^9 は水素原子であつてはならないし、また R^9 が基-NR¹⁰R¹¹であつて且つ R^{11} が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であつてはならない。また R^1 が水素原子で、 R^2 が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは R^2 と R^3 とが一緒になつてオキシ基を形成するとき、 R^9 はフェニル環上に置換基として水酸基、低級ア

ルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはならない。またR⁹が基

【化6】

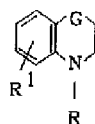


【化7】

$$\begin{array}{c} R^2 \quad R^3 \\ \diagdown \quad \diagup \\ X \end{array}$$
を
示すとき、Xはメチレン基又は基=CH-であってはならない。またR¹⁰及びR¹¹は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはならない。またR¹及びR²が同時に水素原子を示すとき、Rは無置換のピリジルカルボニル基、無置換のチエニルカルボニル基、無置換のチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基であってはならない。更にR³が水素原子、R²が水素原子、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ基、基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m及びuはそれぞれ0又は1を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)又は基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)を示すか、又はR²とR³が一緒になってオキソ基又は低級アルキリデン基を示すとき、R⁹は基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰は低級アルキル基、R¹¹は低級アルキル基を示す。)、水素原子、低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基又は低級アルキル基であってはならない。]で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有する医薬組成物。

【請求項2】 一般式

【化8】

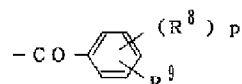


【化9】

$$\begin{array}{c} R^2 \quad R^3 \\ \diagdown \quad \diagup \\ X \end{array}$$
を
示す。R⁴は水素原子、又はハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又

は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。R²は、基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。);水素原子;水酸基;低級アルコキシ基;カルボキシ置換低級アルキル基;シアノ置換低級アルキル基;テトラゾリル基置換低級アルキル基;低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基;低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基;置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基;低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基;カルボキシ置換低級アルコキシ基;低級アルカノイル基;又は基-(O)m-A-(CO)uNR⁶R⁷(m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であってはならない。Aは低級アルキレン基を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶及びR⁷は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5〜7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)を示す。R³は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。またR²とR³とは、これらが一緒になってオキソ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基;9-オキソフルオレニル基;キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基;アダマンチルカルボニル基;チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基;チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基;シクロアルキルカルボニル基又は基

【化10】



級アルコキシ基を示す。 R^9 は、基 $-NR^{10}R^{11}$ (R^{10} は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。 R^{11} は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【化11】

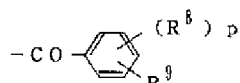


、テトラヒドロイソキノリンカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。また R^{10} 及び R^{11} は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあ

るフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい)；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基 $-(A)m-CHR^{12}R^{13}$ (A は前記に同じ。 R^{12} は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。 R^{13} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。 m は0又は1を示す。)を示す。 X はメチレン基、単結合、基 $=CH-$ 又は基 $-NR^{14}-$ (R^{14} は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。 Y は $-NR^A-$ を示す (R^A は水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基 $-ACONR^BR^C$ を示す。ここで R^B 及び R^C は、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこの R^B 及び R^C は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す

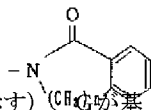
す。但し、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$ (m は1、 u は0又は1を示す。 R^6 及び R^7 が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、 R^6 及び R^7 がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～6員環の飽和複素環を形成する (該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい))、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；又は R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する； R が基

【化12】



であって、 R^8 が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 R^9 は水素原子であってはならないし、また R^9 が基 $-NR^{10}R^{11}$ であって且つ R^{11} が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはならない。また R^1 が水素原子で、 R^2 が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミノ基であるか、或いは R^2 と R^3 とが一緒になってオキシ基を形成するとき、 R^9 はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはならない。また R^9 が基

【化13】



(n は1又は2を示す) (R⁸が基

【化14】



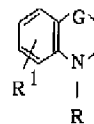
(R^2 及び R^3 は前記に同じ) X を示すとき、 X はメチレン基又は基 $=CH-$ であってはならない。更に R^{10} 及び R^{11} は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはならない。) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するパゾプレシン拮抗用医薬組成物。

【請求項3】 請求項2に記載のベンゾヘテロ環誘導体

及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するオキシトシン拮抗用医薬組成物。

【請求項4】 一般式

【化15】



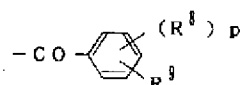
【式中Gは

【化16】

を示す。 R^2 は水素原子、又は基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は、同一又は異なって、水素原子、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。 R^2 は、基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。)；水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基；カルボキシ基置換低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；又は基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$ (m 及び u はそれぞれ0又は1を示す。但し m 及び u は同時に0であってはならない。 A は低級アルキレン基を示す。 R^6 及び R^7 は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。 R^6 及び R^7 は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)を示す。 R^3 は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。また R^2 と R^3 とは、これらが一緒になってオキシ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカル

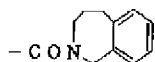
ボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基；シクロアルキルカルボニル基又は基

【化17】



(pは1又は2を示す。R⁸は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹は、基-NR¹⁰R¹¹ (R¹⁰は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【化18】



、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。またR¹⁰及びR¹¹は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい)；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミ

ノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)m—CHR¹²R¹³(Aは前記に同じ。R¹²は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。)を示す。)Xはメチレン基、単結合、基=CH—又は基—NR¹⁴—(R¹⁴は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。Yは—NR^A—を示す

(R^Aは水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基—ACONR^BR^Cを示す。ここでR^B及びR^Cは、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこのR^B及びR^Cは、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩から選ばれた少なくとも1種を含有するパソプレシン作用医薬組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、ベンゾヘテロ環誘導体を含有する医薬組成物に関する。

【0002】

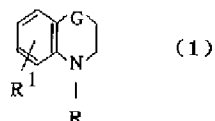
【発明が解決しようとする課題】本発明は、パソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤、パソプレシン作用剤等として有用な医薬組成物を提供することを課題とする。

【0003】

【課題を解決するための手段】本発明の医薬組成物中に含有されるベンゾヘテロ環誘導体は、下記一般式(1)で表わされる。

【0004】

【化19】



【0005】〔式中Gは

【0006】

【化20】

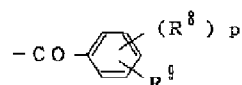
【0007】を $\begin{matrix} R^2 & R^3 \\ \diagdown & / \\ X & \\ / & \diagdown \\ R^2 & R^3 \end{matrix}$ を示す。R¹は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル

ル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基を示す。R²は、基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は、同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。)；水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；又は基—

(O)m—A—(CO)uNR⁶R⁷(m及びuはそれぞれ0又は1を示す。但しm及びuは同時に0であってはならない。Aは低級アルキレン基を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。R⁶及びR⁷は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)を示す。R³は、水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。またR²とR³とは、これらが一緒になってオキソ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成してもよい。Rは、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレン基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基；シクロアルキルカルボニル基又は基

【0008】

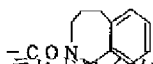
【化21】



【0009】(pは1又は2を示す。R⁸は、水素原子、低級アルキル基、水酸基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は低級アルコキシ基を示す。R⁹は、基-NR¹⁰R¹¹(R¹⁰は水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。R¹¹は低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり且つ低級アルカノイル基部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基；キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、基

【0010】

【化22】



【0011】、テトラヒドロキノリルカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基を示す。またR¹⁰及びR¹¹は、これらが結合する窒素原子と共にイソインドリン環を形成してもよい。)；水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級ア

ルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；シクロアルキル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい)；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基-(A)m-CHR¹²R¹³(Aは前記に同じ。R¹²は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。)を示す。)Xはメチレン基、単結合、基=CH-又は基-NR¹⁴- (R¹⁴は水素原子、低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。)を示す。Yは-NR^A-を示す(R^Aは水素原子、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基又は基-ACONR^BR^Cを示す。ここでR^B及びR^Cは、同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またこ

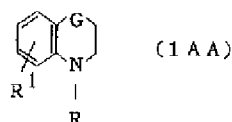
の R^B 及び R^C は、これらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい。)を示す。

【0012】本発明者らの研究によれば、上記一般式(1)のベンゾヘテロ環誘導体及びその塩は、優れたバソプレシン拮抗作用、オキシトシン拮抗作用及びバソプレシン作働作用を有することが見出された。

【0013】上記一般式(1)において、下記一般式(1AA)で表されるベンゾヘテロ環誘導体及びその塩は、文献未記載の新規化合物である。

【0014】

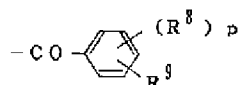
【化23】



【0015】〔式中G、 R^1 及びRは前記に同じ。但し、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 が同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はベンゾイル基を示す。)、水素原子、水酸基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基、基 $-(O)m-A-(CO)uN R^6R^7$ (mは1、uは0又は1を示す。 R^6 及び R^7 が同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示すか、 R^6 及び R^7 がこれらが結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5～6員環の飽和複素環を形成する(該複素環上に低級アルキル基が置換していてもよい))、又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；又は R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を形成する；Rが基

【0016】

【化24】

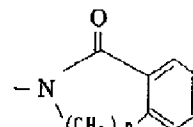


【0017】であって、 R^8 が水素原子、低級アルキル基、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基又はアミノ基をそれぞれ示すとき、 R^9 は水素原子であってはいならないし、また R^9 が基 $-NR^{10}R^{11}$ であって且つ R^{11} が低級アルカノイル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基、アミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基であってはいならない。また R^1 が水素原子で、 R^2 が水素原子、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基又はジ低級アルキルアミ

ノ基であるか、或いは R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成するとき、 R^9 はフェニル環上に置換基として水酸基、低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルカノイルオキシ基を有することのあるフェニル基であってはいならない。また R^9 が基

【0018】

【化25】



【0019】(nは1又は2を示す)、Gが基

【0020】

【化26】



【0021】(R^2 及び R^3 は前記に同じ)を示すとき、Xはメチレン基又は基 $=CH-$ であってはいならない。また R^{10} 及び R^{11} は、一方が水素原子である場合、他方は低級アルキル基であってはいならない。また R^1 及び R^2 が同時に水素原子を示すとき、Rは無置換のピリジルカルボニル基、無置換のチエニルカルボニル基、無置換のチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基であってはいならない。また R^1 、 R^2 及び R^3 が水素原子、Gが基

【0022】

【化27】



【0023】(R^2 及び R^3 は前記に同じ)、Xが単結合を示すとき、Rは無置換のキノリルカルボニル基であってはいならない。更に R^3 が水素原子、 R^2 が水素原子、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ基、基 $-(O)m-A-(CO)uN R^6R^7$ (mが1、uが0又は1を示す。 R^6 及び R^7 は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)又は基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。)を示すか、又は R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基又は低級アルキリデン基を示すとき、 R^9 は基 $-NR^{10}R^{11}$ (R^{10} は低級アルキル基、 R^{11} は低級アルキル基を示す。)、水素原子、低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基又は低級アルキル基であってはいならない。]

本発明のバソプレシン拮抗用医薬組成物は、例えば血管拡張作用、血圧降下作用、肝糖放出抑制作用、メサンギウム細胞増殖抑制作用、利尿作用、血小板凝集抑制作用、嘔吐抑制作用、尿素排泄促進作用、第VIII因子分泌

抑制作用、心機能亢進作用、メサングウム細胞収縮抑制作用、肝糖新生抑制作用、アルドステロン分泌抑制作用、エンドセリン産生抑制作用、レニン分泌調節作用、記憶調節作用、体温調節作用、プロスタグランジン産生調節作用等を有し、血管拡張剤、降圧剤、水利尿剤、血小板凝集抑制剤、尿素排泄促進剤、抗心不全剤、抗腎不全剤等として有用であり、高血圧、浮腫、腹水、心不全、腎機能障害、バソプレシン分泌異常症候群（S I A D H）、肝硬変、低ナトリウム血症、低カリウム血症、糖尿病、循環不全、動揺病、水代謝障害、腎不全、各種虚血性疾患等の予防及び治療に有効である。更に本発明の化合物は、副作用が少なく、薬効の持続時間が長いという特徴を有している。

【0024】本発明のオキシトシン拮抗用医薬組成物は、例えば子宮平滑筋収縮抑制作用、乳汁放出抑制作用、プロスタグランジン合成及び放出抑制作用、血管拡張作用を有し、オキシトシン関連疾患、特に早期分娩、帝王切開前の出産の阻止、月経困難等の予防乃至治療に有効である。

【0025】本発明のバソプレシン作働用医薬組成物は、様々な排尿障害、大量尿又は出血状態に有用であり、頻尿、尿崩症、尿失禁、遺尿症特に夜尿症、自然発生性出血、血友病、von Willebrand病、尿毒症、先天的又は後天的血小板機能障害、外傷性及び手術時出血、肝硬変等の診断、予防乃至治療に有効である。

【0026】

【発明の実施の形態】本発明の一般式（1）のベンゾヘテロ環誘導体には、下記の種々の態様の化合物が含まれる。

【0027】（1）Gが基-C（R²）（R³）-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R¹が前記一般式（1）における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵（R⁴及びR⁵は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rがピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジカルボニル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（2）G、X、R¹、R³及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（3）G、X、R¹、R³及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（4）G、X、R¹、R³及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（5）G、X、R¹、R³及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（6）G、X、R¹、R³及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（7）G、X、R¹、R³及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（8）G、X、R¹及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（9）G、X、R¹及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（10）G、X、R¹及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0028】（11）G、X、R¹及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（12）G、X、R¹及びRは前記（1）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（13）Gが基-C（R²）（R³）-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R¹が前記一般式（1）における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵（R⁴及びR⁵は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基（R⁹及びpは前記一般式（1）における定義に同じ。R⁸は水素原子を示す。）である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（14）G、X、R¹、R³及びRは前記（13）の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（15）G、X、R¹、R³及びRは前記（13）の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（16）G、X、R¹、R³及びRは前記（13）の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基で

ある前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(17) G、X、R¹、R³及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(18) G、X、R¹、R³及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(19) G、X、R¹、R³及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(20) G、X、R¹及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0029】(21) G、X、R¹及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(22) G、X、R¹及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(23) G、X、R¹及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(24) G、X、R¹及びRは前記(13)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(25) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(26) G、X、R¹、R³及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(27) G、X、R¹、R³及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(28) G、X、R¹、R³及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(29) G、X、R¹、R³及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(30) G、X、R¹、R³及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0030】(31) G、X、R¹、R³及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(32) G、X、R¹及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(33) G、X、R¹及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(34) G、X、R¹及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(35) G、X、R¹及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(36) G、X、R¹及びRは前記(25)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(37) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R⁸は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(38) G、X、R¹、R³及びRは前記(37)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(39) G、X、R¹、R³及びRは前記(37)の定義

に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(40) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0031】(41) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(42) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(43) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(44) G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(45) G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(46) G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(47) G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(48) G、X、 R^1 及びRは前記(37)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(49) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R^9 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 R^8 はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(50) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)

で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0032】(51) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(52) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(53) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(54) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(55) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(56) G、X、 R^1 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(57) G、X、 R^1 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(58) G、X、 R^1 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(59) G、X、 R^1 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(60) G、X、 R^1 及びRは前記(49)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0033】(61) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5

(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アル

キル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(62) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(63) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(64) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(65) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(66) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(67) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(68) G、X、 R^1 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(69) G、X、 R^1 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(70) G、X、 R^1 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0034】(71) G、X、 R^1 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(72) G、X、 R^1 及びRは前記(61)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(73) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前

記〔化5〕で示される基(R^9 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(74) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(75) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(76) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(77) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(78) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(79) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(80) G、X、 R^1 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0035】(81) G、X、 R^1 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(82) G、X、 R^1 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(83) G、X、 R^1 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(84) G、X、 R^1 及びRは前記(73)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(85) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基-N R^{14} -(R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義

に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(86) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(87) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(88) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(89) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(90) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0036】(91) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(92) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(93) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(94) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(95) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(96) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(85)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされる

ベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(97) G が基- $C(R^2)(R^3)-X$ を示し、 X が基- NR^{14} - (R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基- NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R が前記【化5】で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(98) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(99) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(100) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0037】(101) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(102) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(103) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(104) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(105) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(106) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(107) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(97)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(108) G、X、 R^1 及びRは前記(97)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(109) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴-(R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R^9 は及びp前記一般式

(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(110) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0038】(111) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(112) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(113) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(114) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩 (115) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(116) G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(117) G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(118) G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(119) G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義

に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(120) G、X、 R^1 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0039】(121) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴-(R^{14} は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(122) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(123) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(124) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(125) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(126) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(127) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(128) G、X、 R^1 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(129) G、X、 R^1 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(130) G、X、 R^1 及びRは前記(121)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ

置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0040】(131) G、X、R¹及びRは前記(121)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(132) G、X、R¹及びRは前記(121)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(133) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴- (R¹⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R⁸はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(134) G、X、R¹、R³及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(135) G、X、R¹、R³及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(136) G、X、R¹、R³及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(137) G、X、R¹、R³及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(138) G、X、R¹、R³及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(139) G、X、R¹、R³及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(140) G、X、R¹及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0041】(141) G、X、R¹及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低

級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(142) G、X、R¹及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(143) G、X、R¹及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(144) G、X、R¹及びRは前記(133)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(145) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴- (R¹⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R⁸はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(146) G、X、R¹、R³及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(147) G、X、R¹、R³及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(148) G、X、R¹、R³及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(149) G、X、R¹、R³及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(150) G、X、R¹、R³及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0042】(151) G、X、R¹、R³及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(152) G、X、R¹及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導

体又はその塩

(153) G、X、R¹及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(154) G、X、R¹及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(155) G、X、R¹及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(156) G、X、R¹及びRは前記(145)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(157) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴- (R¹⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(158) G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(159) G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(160) G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0043】(161) G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(162) G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(163) G、X、R¹、R³及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(164) G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(165) G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(166) G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(167) G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(168) G、X、R¹及びRは前記(157)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(169) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xがメチレン基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが9-オキソフルオレン基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(170) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0044】(171) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(172) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(173) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(174) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(175) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(176) G、X、R¹及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(177) G、X、R¹及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(178) G、X、R¹及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(179) G、X、R¹及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(180) G、X、R¹及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0045】(181) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴- (R¹⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式

(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが9-オキシフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(182) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(183) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(184) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(185) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(186) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(187) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前

記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(188) G、X、R¹及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(189) G、X、R¹及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(190) G、X、R¹及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(191) G、X、R¹及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(192) G、X、R¹及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(193) G、X、R¹、R³及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(194) G、X、R¹、R³及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(195) G、X、R¹、R³及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(196) G、X、R¹、R³及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(197) G、X、R¹、R³及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(198) G、X、R¹及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(199) G、X、R¹、R³及びRは前記(1)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-(CO)uN R⁶R⁷ (m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(236) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(73)の定

(248) G、X、R¹、R³及びRは前記(85)の定義に同じであり、R²が基—(O)_m—A—(CO)_u

(260) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(109)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基

(272) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(133)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アル

ロ環誘導体又はその塩

(297) G、X、R¹、R³及びRは前記(169)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式

(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(298) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(299) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(300) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0056】(301) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(302) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(303) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(304) G、X、R¹、R³及びRは前記(181)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式

(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(305) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びPは前記一般式

(1)における定義に同じ。R⁸は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(306) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(307) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(308) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(309) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(310) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0057】(311) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(312) G、X、R¹及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(313) G、X、R¹及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(314) G、X、R¹及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(315) G、X、R¹及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(316) G、X、R¹及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(317) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(318) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(319) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(320) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0058】(321) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(322) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(323) G、X、R¹、R³及びRは前記(305)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(324) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(325) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(326) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(327) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(328) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(329) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(330) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0059】(331) G、X、R¹及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオ

キシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(332) G、X、R¹及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(333) G、X、R¹及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(334) G、X、R¹及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(335) G、X、R¹及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(336) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(337) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(338) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(339) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(340) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0060】(341) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(342) G、X、R¹、R³及びRは前記(324)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(343) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における

定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(344) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(345) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(346) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(347) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(348) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(349) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(350) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0061】(351) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(352) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(353) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(354) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(355) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

の塩

(356) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(357) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(358) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(359) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(360) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0062】(361) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(343)の定義に同じであり、 R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$ (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(362) G が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X がメチレン基を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(363) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(364) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(365) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(366) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(367) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(362)の

定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(368) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(369) G、X、 R^1 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(370) G、X、 R^1 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0063】(371) G、X、 R^1 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(372) G、X、 R^1 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(373) G、X、 R^1 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(374) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(375) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(376) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(377) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(378) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(379) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の

定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(380) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(362)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0064】(381) Gが基—C(R^2)(R^3)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基—NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(382) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(383) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(384) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(385) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(386) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(387) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(388) G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(389) G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(390) G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ

置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0065】(391) G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(392) G、X、 R^1 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(393) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(394) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(395) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(396) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(397) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(398) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(399) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(381)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(400) Gが基—C(R^2)(R^3)—X—を示し、Xがメチレン基を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基—NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0066】(401) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

はその塩

(402) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(403) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(404) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(405) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(406) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(407) G、X、 R^1 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(408) G、X、 R^1 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(409) G、X、 R^1 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(410) G、X、 R^1 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0067】(411) G、X、 R^1 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(412) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(413) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(400)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(414) G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(415) G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(416) G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(417) G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(418) G、X、R¹、R³及びRは前記(400)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(419) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xが基—NR¹⁴—(R¹⁴は前記一般式(1)における定義に同じ。)基を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(420) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0068】(421) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(422) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(423) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(424) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ

基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(425) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(426) G、X、R¹及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(427) G、X、R¹及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(428) G、X、R¹及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(429) G、X、R¹及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(430) G、X、R¹及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0069】(431) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(432) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(433) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(434) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(435) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(436) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(437) G、X、R¹、R³及びRは前記(419)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(438) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xが基—NR¹⁴—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹及びR¹⁴が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(439) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(440) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0070】(441) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(442) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(443) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(444) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(445) G、X、R¹及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(446) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(447) G、X、R¹及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(448) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(449) G、X、R¹及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(450) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0071】(451) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(452) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(453) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(454) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(455) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(456) G、X、R¹、R³及びRは前記(438)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(457) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xが基—NR¹⁴—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹及びR¹⁴が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(458) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(459) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(460) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(461) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(462) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(463) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(460) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0072】(461) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(462) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(463) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(464) G、X、R¹及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(465) G、X、R¹及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(466) G、X、R¹及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(467) G、X、R¹及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(468) G、X、R¹及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(469) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(470) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0073】(471) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(472) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の

定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(473) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(474) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(475) G、X、R¹、R³及びRは前記(457)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(476) Gが基—C(R²)(R³)—X—を示し、Xが基—NR¹⁴—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹及びR¹⁴が前記一般式

(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(477) G、X、R¹、R³及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(478) G、X、R¹、R³及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(479) G、X、R¹、R³及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(480) G、X、R¹、R³及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0074】(481) G、X、R¹、R³及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(482) G、X、R¹、R³及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(483) G、X、R¹及びRは前記(476)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(484) G、X、 R^1 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(485) G、X、 R^1 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(486) G、X、 R^1 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(487) G、X、 R^1 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(488) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(489) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(490) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0075】(491) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(492) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(493) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(494) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(476)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)—m—A—(CO)—u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(495) Gが基—C(R^2)(R^3)—X—を示し、Xが基—NR¹⁴—を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 及びR¹⁴が前記一般式

(1)における定義に同じであり、 R^2 が基—NR⁴R⁵(R^4 及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(496) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(497) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(498) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(499) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(500) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0076】(501) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(502) G、X、 R^1 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(503) G、X、 R^1 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(504) G、X、 R^1 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(505) G、X、 R^1 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(506) G、X、 R^1 及びRは前記(495)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(507) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(495)の

定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(508) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(509) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(510) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0077】(511) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(512) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(513) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(495)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O) m —A—(CO) u — NR^6R^7 (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(514) G が基—C(R^2)(R^3)— X —を示し、 X が基— NR^{14} —を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 及び R^{14} が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基— NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(515) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(516) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(517) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(518) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(519) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(520) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0078】(521) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(522) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(523) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(524) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(525) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(526) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(527) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(528) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(529) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(530) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0079】(531) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記

(514) の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(532) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(514)の定義に同じであり、 R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$ (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体またはその塩

(533) G が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジン基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(534) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(535) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(536) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(537) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(538) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(539) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(540) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0080】(541) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(542) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(533)の定義

に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(543) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(544) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(533)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(545) G が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R が前記【化5】で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(546) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(547) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(548) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(549) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(550) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0081】(551) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(552) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0082】(553) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(545)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(554) G、X、R¹及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(555) G、X、R¹及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(556) G、X、R¹及びRは前記(545)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(557) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが単結合を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(558) G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(559) G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(560) G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0083】(561) G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(562) G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(563) G、X、R¹、R³及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(564) G、X、R¹及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(565) G、X、R¹及びRは前記(557)の定義

に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(566) G、X、R¹及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(567) G、X、R¹及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(568) G、X、R¹及びRは前記(557)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(569) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが単結合を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(570) G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0084】(571) G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(572) G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(573) G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(574) G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(575) G、X、R¹、R³及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(576) G、X、R¹及びRは前記(569)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(577) G、X、 R^1 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(578) G、X、 R^1 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(579) G、X、 R^1 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(580) G、X、 R^1 及びRは前記(569)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0085】(581) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが単結合を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級ニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(582) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(583) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(584) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(585) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(586) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(587) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(588) G、X、 R^1 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(589) G、X、 R^1 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(590) G、X、 R^1 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0086】(591) G、X、 R^1 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(592) G、X、 R^1 及びRは前記(581)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(593) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(594) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(595) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(596) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(597) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(598) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(593)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(599) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(593)の

定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(600) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(593)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0087】(601) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(593)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(602) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(593)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(603) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(593)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(604) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(593)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(605) G が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R が前記〔化5〕で示される基(R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(606) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(607) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(608) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(609) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(610) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環

誘導体又はその塩。

【0088】(611) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(612) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(613) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(614) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(615) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(616) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(605)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(617) G が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X が単結合を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R が9-オキソフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(618) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(619) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(620) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0089】(621) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(622) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(617)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環

誘導体又はその塩

(623) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(624) G、X、R¹及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(625) G、X、R¹及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(626) G、X、R¹及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(627) G、X、R¹及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(628) G、X、R¹及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(629) Gが基-C(R²)(R³)-X-を示し、Xが単結合を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記[化5]で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(630) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0090】(631) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(632) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(633) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(634) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(635) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(636) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(637) G、X、R¹及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(638) G、X、R¹及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(639) G、X、R¹及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(640) G、X、R¹及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0091】(641) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(642) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(643) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(644) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(645) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の定義に同じであり、R²が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(646) G、X、R¹、R³及びRは前記(629)の

定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(647) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(629)の定義に同じであり、 R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$ (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(648) G が基 $-C(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(649) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(650) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0092】(651) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(652) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(653) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(654) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(655) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(656) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(657) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)

で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(658) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(659) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(660) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0093】(661) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(662) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(663) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(664) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(665) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(666) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(648)の定義に同じであり、 R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$ (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(667) G が基 $(R^2)(R^3)-X-$ を示し、 X が単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(668) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(667)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(669) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(667)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(670) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0094】(671) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(672) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(673) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(674) G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(675) G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(676) G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(677) G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(678) G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(679) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(680) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0095】(681) G、X、R¹及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(682) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(683) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(684) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(685) G、X、R¹、R³及びRは前記(667)の定義に同じであり、R²が基—(O)^m—A—(CO)^u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(686) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが単結合を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(687) G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(688) G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(689) G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(690) G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0096】(691) G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(692) G、X、R¹、R³及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(693) G、X、R¹及びRは前記(686)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(694) G、X、 R^1 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(695) G、X、 R^1 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(696) G、X、 R^1 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(697) G、X、 R^1 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(698) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(699) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(700) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0097】(701) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(702) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(703) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(704) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(686)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(705) Gが基(R^2)(R^3)—X—を示し、Xが単結合を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同

じであり、 R^2 が基—NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(706) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(707) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(708) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(709) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(710) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0098】(711) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(712) G、X、 R^1 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(713) G、X、 R^1 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(714) G、X、 R^1 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(715) G、X、 R^1 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(716) G、X、 R^1 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(717) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(705)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記

一般式 (1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(718) G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(719) G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(720) G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0099】(721) G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(722) G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(723) G、X、R¹、R³及びRは前記(705)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(724) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが単結合を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(725) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(726) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(727) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(728) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(729) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基

を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(730) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0100】(731) G、X、R¹及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(732) G、X、R¹及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(733) G、X、R¹及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(734) G、X、R¹及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(735) G、X、R¹及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(736) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(737) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(738) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(739) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(740) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0101】(741) G、X、R¹、R³及びRは前記(724)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされ

(777) G、X、R¹、R³及びRは前記(581)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)

(789) G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表されるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(790) G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0106】(791) G、X、R¹、R³及びRは前記(605)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(792) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(793) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(794) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(795) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(796) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(797) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(798) G、X、R¹、R³及びRは前記(617)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)uNR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(799) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがピリジル環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジンカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(800) G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の

定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0107】(801) G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(802) G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(803) G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(804) G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(805) G、X、R¹、R³及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(806) G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(807) G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(808) G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(809) G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(810) G、X、R¹及びRは前記(799)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0108】(811) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R³が水素原子を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は水素原子を示す。)である前記一般式(1)

で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(812) G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(813) G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(814) G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(815) G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(816) G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(817) G、X、R¹、R³及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(818) G、X、R¹及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(819) G、X、R¹及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(820) G、X、R¹及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0109】(821) G、X、R¹及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(822) G、X、R¹及びRは前記(811)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(823) Gが基(R²)(R³)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記

【化5】で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(824) G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(825) G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(826) G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(827) G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(828) G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(829) G、X、R¹、R³及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(830) G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0110】(831) G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(832) G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(833) G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(834) G、X、R¹及びRは前記(823)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(835) Gが基(R²)(R³)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義

に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R が前記〔化5〕で示される基 (R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(836) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(837) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(838) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(839) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(840) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0111】(841) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(842) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(843) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(844) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(845) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(846) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(835)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(847) G が基(R^2)(R^3)- X -を示し、 X が基

$=CH-$ を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R が前記〔化5〕で示される基 (R^9 及び p は前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 はニトロ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(848) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(849) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(850) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0112】(851) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(852) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(853) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(854) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(855) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(856) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(857) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(858) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(847)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(859) Gが基(R²)(R³)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸はハロゲン原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(860) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0113】(861) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(862) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(863) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(864) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(865) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(866) G、X、R¹及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(867) G、X、R¹及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(868) G、X、R¹及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(869) G、X、R¹及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(870) G、X、R¹及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0114】(871) Gが基(R²)(R³)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(872) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(873) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(874) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(875) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(876) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(877) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(878) G、X、R¹及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(879) G、X、R¹及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(880) G、X、R¹及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0115】(881) G、X、R¹及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低

級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(882) G、X、 R^1 及びRは前記(871)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(883) Gが基(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが9-オキソフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(884) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(885) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(886) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(887) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(888) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(889) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(890) G、X、 R^1 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0116】(891) G、X、 R^1 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(892) G、X、 R^1 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(893) G、X、 R^1 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ

カルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩
(894) G、X、 R^1 及びRは前記(883)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(895) Gが基(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基=CH-を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-N R^4 R R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rが前記〔化5〕で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(896) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(897) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(898) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(899) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(900) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0117】(901) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(902) G、X、 R^1 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(903) G、X、 R^1 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(904) G、X、 R^1 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で

表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(905) G、X、 R^1 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(906) G、X、 R^1 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(907) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(908) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(909) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(910) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0118】(911) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(912) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(913) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(895)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(914) Gが基(R^2)(R^3)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基—NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(915) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(916) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の

定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(917) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(918) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(919) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(920) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0119】(921) G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(922) G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(923) G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(924) G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(925) G、X、 R^1 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(926) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(927) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(928) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(914)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテ

ロ環誘導体又はその塩

(929) G、X、R¹、R³及びRは前記(914)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(930) G、X、R¹、R³及びRは前記(914)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0120】(931) G、X、R¹、R³及びRは前記(914)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(932) G、X、R¹、R³及びRは前記(914)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(933) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(934) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(935) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(936) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(937) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(938) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(939) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(940) G、X、R¹及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成

する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0121】(941) G、X、R¹及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(942) G、X、R¹及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(943) G、X、R¹及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(944) G、X、R¹及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(945) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(946) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(947) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(948) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(949) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(950) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0122】(951) G、X、R¹、R³及びRは前記(933)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(952) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級ア

ルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(953) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(954) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(955) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(956) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(957) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(958) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(959) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(960) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0123】(961) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(962) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(963) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(964) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(965) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(966) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(967) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(968) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(969) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(970) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(952)の定義に同じであり、 R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)u-NR^6R^7$ (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0124】(971) G が基(R^2)(R^3)- X -を示し、 X が基 $=CH-$ を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基 $-NR^4R^5$ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(972) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(973) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(974) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(975) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(971)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされる

ベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(976) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(977) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(978) G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(979) G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(980) G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0125】(981) G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(982) G、X、R¹及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(983) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(984) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(985) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(986) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(987) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わさ

れるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(988) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(989) G、X、R¹、R³及びRは前記(971)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(990) Gが基(R²)(R³)—X—を示し、Xが基=CH—を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0126】(991) G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(992) G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(993) G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(994) G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(995) G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(996) G、X、R¹、R³及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(997) G、X、R¹及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(998) G、X、R¹及びRは前記(990)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(999) G、X、R¹及びRは前記(990)の定義

に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1000) G、X、 R^1 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0127】(1001) G、X、 R^1 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1002) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1003) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1004) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1005) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1006) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1007) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1008) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(990)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1009) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1010) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0128】(1011) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前

記(799)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1012) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1013) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1014) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1015) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(799)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1016) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1017) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1018) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1019) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1020) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0129】(1021) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1022) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(811)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1023) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(823)

(1035) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(835)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アル

(1047) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(859)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基

置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1048) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1049) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1050) G、X、R¹、R³及びRは前記(859)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0132】(1051) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1052) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1053) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1054) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1055) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1056) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1057) G、X、R¹、R³及びRは前記(871)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1058) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1059) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基

である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1060) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0133】(1061) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1062) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1063) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1064) G、X、R¹、R³及びRは前記(883)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1065) Gが基—Y—C(R²)(R³)—を示し、Yが基—NR^A—(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rがピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1066) G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1067) G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1068) G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1069) G、X、R¹、R³及びRは前記(1065)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1070) G、X、R¹、R³及びRは前記(106

5) の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0134】(1071) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1072) G、X、 R^1 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1073) G、X、 R^1 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1074) G、X、 R^1 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1075) G、X、 R^1 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1076) G、X、 R^1 及びRは前記(1065)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1077) Gが基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Yが基-NR^A-(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R^9 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 R^8 は水素原子を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1078) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1079) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1080) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0135】(1081) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1082) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1083) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1084) G、X、 R^1 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1085) G、X、 R^1 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1086) G、X、 R^1 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1087) G、X、 R^1 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1088) G、X、 R^1 及びRは前記(1077)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1089) Gが基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Yが基-NR^A-(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R^9 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルキル基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1090) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0136】(1091) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1089)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基であ

る前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1092) G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1093) G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1094) G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1095) G、X、R¹、R³及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1096) G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1097) G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1098) G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1099) G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1100) G、X、R¹及びRは前記(1089)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0137】(1101) Gが基-Y-C(R²)

(R³)-を示し、Yが基-NR^A- (R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記[化5]で示される基(R⁹及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。R⁸は水酸基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1102) G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1103) G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1104) G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1105) G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1106) G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1107) G、X、R¹、R³及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1108) G、X、R¹及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1109) G、X、R¹及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1110) G、X、R¹及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0138】(1111) G、X、R¹及びRは前記

(1101)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1112) G、X、R¹及びRは前記(1101)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1113) Gが基-Y-C(R²)(R³)-を示し、Yが基-NR^A- (R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が

水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基（R⁹及びpは前記一般式

（1）における定義に同じ。R⁸はニトロ基を示す。）である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1114）G、X、R¹、R³及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1115）G、X、R¹、R³及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1116）G、X、R¹、R³及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1117）G、X、R¹、R³及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1118）G、X、R¹、R³及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1119）G、X、R¹、R³及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1120）G、X、R¹及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0139】（1121）G、X、R¹及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1122）G、X、R¹及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1123）G、X、R¹及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1124）G、X、R¹及びRは前記（1113）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1125）Gが基-Y-C（R²）（R³）-を示し、Yが基-NR^A-（R^Aは前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R¹が前記一般式（1）における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵（R⁴及びR⁵は前記一般式（1）における定義に同じ。）を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記〔化5〕で示される基（R⁹及びpは前記一般式

（1）における定義に同じ。R⁸はハロゲン原子を示す。）である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1126）G、X、R¹、R³及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1127）G、X、R¹、R³及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1128）G、X、R¹、R³及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1129）G、X、R¹、R³及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1130）G、X、R¹、R³及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0140】（1131）G、X、R¹、R³及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1132）G、X、R¹及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1133）G、X、R¹及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1134）G、X、R¹及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1135）G、X、R¹及びRは前記（1125）の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式（1）で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその

の塩

(1136) G、X、 R^1 及びRは前記(1125)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1137) Gが基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Yが基-NR^A-(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R^9 及びpは前記一般式

(1)における定義に同じ。 R^8 は低級アルコキシ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1138) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1139) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1140) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0141】(1141) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1142) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1143) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1144) G、X、 R^1 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1145) G、X、 R^1 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1146) G、X、 R^1 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1147) G、X、 R^1 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1148) G、X、 R^1 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1149) Gが基-Y-C(R^2)(R^3)-を示し、Yが基-NR^A-(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが9-オキシフルオレニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1150) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0142】(1151) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1152) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1153) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1154) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1155) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1156) G、X、 R^1 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1157) G、X、 R^1 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベン

ゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1158) G、X、 R^1 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1159) G、X、 R^1 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1160) G、X、 R^1 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0143】(1161) Gが基-Y-C(R^2)

(R^3) -を示し、Yが基-NR^A- (R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基-NR⁴R⁵ (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、Rが前記【化5】で示される基(R^9 及びpは前記一般式(1)における定義に同じ。 R^8 は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1162) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1163) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1164) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1165) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1166) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1167) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1168) G、X、 R^1 及びRは前記(1161)の

定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1169) G、X、 R^1 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1170) G、X、 R^1 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1) で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0144】(1171) G、X、 R^1 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1172) G、X、 R^1 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1173) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1174) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1175) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1176) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1177) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1178) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1179) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1161)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-

(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1180) Gが基-Y-C(R^2) (R^3) -を示し、

Yが基-NR^A- (R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがキノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0145】(1181) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1182) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1183) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1184) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1185) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1186) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1187) G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1188) G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1189) G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1190) G、X、R¹及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0146】(1191) G、X、R¹及びRは前記

(1180)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1192) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1193) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1194) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1195) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1196) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1197) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1198) G、X、R¹、R³及びRは前記(1180)の定義に同じであり、R²が基-(O)m-A-

(CO)u-NR⁶R⁷ (m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1199) Gが基-Y-C (R²) (R³) -を示し、Yが基-NR^A- (R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基-NR⁴R⁵ (R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがアダマンチルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1200) G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0147】(1201) G、X、R¹、R³及びRは前記(1199)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1202) G、X、R¹、R³及びRは前記(119

9) の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1203) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1204) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1205) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1206) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1207) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1208) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1209) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1210) G 、 X 、 R^1 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0148】(1211) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1212) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1213) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1214) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)

9) の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1215) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1216) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1217) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1199)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)— m —A—(CO)— u — NR^6R^7 (m 、 u 、 A 、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1218) G が基—Y—C(R^2)(R^3)—を示し、Yが基— NR^A —(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基— NR^4R^5 (R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R がチオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1219) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1220) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0149】(1221) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1222) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1223) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1224) G 、 X 、 R^1 、 R^3 及び R は前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1225) G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1226) G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1227) G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式

(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1228) G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1229) G、X、 R^1 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1230) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0150】(1231) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1232) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1233) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1234) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1235) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1236) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1218)の定義に同じであり、 R^2 が基—(O)—m—A—(CO)—u—NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及び R^7 は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1237) Gが基—Y—C(R^2)(R^3)—を示し、Yが基—NR^A—(R^A は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、 R^3 が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、 R^1 が前記一般式(1)における定義に同じであり、 R^2 が基—NR⁴R⁵(R^4 及び R^5 は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1238) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1239) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1240) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0151】(1241) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1242) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1243) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1244) G、X、 R^1 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になってオキソ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1245) G、X、 R^1 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1246) G、X、 R^1 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1247) G、X、 R^1 及びRは前記(1237)の定義に同じであり、 R^2 と R^3 が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1248) G、X、R¹及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1249) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1250) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0152】(1251) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1252) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1253) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1254) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1255) G、X、R¹、R³及びRは前記(1237)の定義に同じであり、R²が基—(O)m—A—(CO)u—NR⁶R⁷(m、u、A、R⁶及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1256) Gが基—Y—C(R²)(R³)—を示し、Yが基—NR^A—(R^Aは前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、R³が水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示し、R¹が前記一般式(1)における定義に同じであり、R²が基—NR⁴R⁵(R⁴及びR⁵は前記一般式(1)における定義に同じ。)を示し、Rがシクロアルキルカルボニル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1257) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が水素原子である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1258) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が水酸基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1259) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²がカルボキシ置換低級ア

ルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1260) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0153】(1261) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1262) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が低級アルカノイル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1263) G、X、R¹及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってオキシ基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1264) G、X、R¹及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1265) G、X、R¹及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシ置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1266) G、X、R¹及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になって低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1267) G、X、R¹及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²とR³が一緒になってフェニル置換低級アルキリデン基を形成する前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1268) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1269) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1270) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0154】(1271) G、X、R¹、R³及びRは前記(1256)の定義に同じであり、R²が低級アルカ

7) の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1320) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0160】(1321) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1322) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1323) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1137)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1324) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1325) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がシアノ置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1326) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がテトラゾリル基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1327) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0161】(1328) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1329) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 がカルボキシ基置換低級アルコキシ基である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1330) G、X、 R^1 、 R^3 及びRは前記(1149)の定義に同じであり、 R^2 が基-(O)m-A-(CO)u-NR⁶R⁷(m、u、A、 R^6 及びR⁷は前記一般式(1)における定義に同じ。)である前記一般式(1)で表わされるベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0162】(1331) Gが基-C(R^2)(R^3)-

X-を示し、Xがメチレン基である請求項1記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0163】(1332) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが単結合である請求項1記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1333) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基-CH-である請求項1記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1334) Gが基-C(R^2)(R^3)-X-を示し、Xが基-NR¹⁴-である請求項1記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1335) Gが基-Y-C(R^2)(R^3)-である請求項1記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1336) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1331)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1337) Rが前記【化5】で示される基である前記(1331)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1338) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1332)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1339) Rが前記【化5】で示される基である前記(1332)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1340) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフェン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチ

アゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1333)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1341) Rが前記〔化5〕で示される基である前記(1333)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0164】(1342) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフエン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1334)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1343) Rが前記〔化5〕で示される基である前記(1334)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1344) Rが、ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基；9-オキソフルオレニル基；キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基；アダマンチルカルボニル基；チオフエン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基又はシクロアルキルカルボニル基である前記(1335)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1345) Rが前記〔化5〕で示される基である前記(1335)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1346) R⁹が基-NR¹⁰R¹¹である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1347) R⁹がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1348) R⁹が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和もしくは不飽和の5~11員環の単環又は二項環の複素環基(該複素環基には置換基として

低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有していてもよい)である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1349) R⁹が水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基-(A)m-CH₂R¹²R¹³(Aは前記に同じ。R¹²は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R¹³はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。)である前記(1337)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1350) R⁹が基-NR¹⁰R¹¹である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1351) R⁹がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記(1343)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0165】(1352) R⁹が窒素原子、酸素原子又は

は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい）である前記（1343）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1353） R^9 が水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)m—CH R^{12} R R^{13} （Aは前記に同じ。R R^{12} は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R R^{13} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。）である前記（1343）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1354） R^9 が基—NR R^{10} R R^{11} である前記（1345）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1355） R^9 がシクロアルキル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基である前記（1345）

に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1356） R^9 が窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい）である前記（1345）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1357） R^9 が水素原子；低級アルカノイルオキシ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；低級アルキルチオ基；フェノキシ基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基；ピロリジニル置換低級アルコキシ基；シクロアルケニル基；フェニル低級アルキルアミノカルボニル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホニルオキシ基；シアノ基；又は基—(A)m—CH R^{12} R R^{13} （Aは前記に同じ。R R^{12} は水素原子、水酸基又は低級アルカノイルオキシ基を示す。R R^{13} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。mは0又は1を示す。）である前記（1345）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1358） R^2 が基—NR R^4 R R^5 であり、 R^3 が水素原子である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1359） R^2 が基—(O)m—A—(CO)uNR R^6 R R^7 であり、 R^3 が水素原子である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1360） R^2 が水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキ

シカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基；カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 R^3 が水素原子である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1361） R^3 が水酸基置換低級アルキル基である前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0166】（1362） R^2 と R^3 とが一緒になってオキソ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記（1347）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1363） R^2 が基 $-NR^4R^5$ であり、 R^3 が水素原子である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1364） R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$ であり、 R^3 が水素原子である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1365） R^2 が水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基；カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 R^3 が水素原子である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1366） R^3 が水酸基置換低級アルキル基である前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1367） R^2 と R^3 とが一緒になってオキソ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記（1351）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1368） R^2 が基 $-NR^4R^5$ であり、 R^3 が水素原子である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1369） R^2 が基 $-(O)m-A-(CO)uNR^6R^7$ であり、 R^3 が水素原子である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1370） R^2 が水素原子；水酸基；低級アルコキシ基；カルボキシ置換低級アルキル基；シアノ置換低級アルキル基；テトラゾリル基置換低級アルキル基；低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基；低級アルコ

シカルボニル置換低級アルキル基；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基；低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基；カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は低級アルカノイル基であり、 R^3 が水素原子である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1371） R^3 が水酸基置換低級アルキル基である前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0167】（1372） R^2 と R^3 とが一緒になってオキソ基、低級アルキリデン基、低級アルコキシ置換低級アルキリデン基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基、又はフェニル置換低級アルキリデン基を形成している前記（1355）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1373） m が0、 n が1、 R^6 及び R^7 が同一又は異なっており、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記（1359）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1374） m が0、 n が1、 R^6 及び R^7 が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する5～7員環の飽和複素環基（該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）である前記（1359）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1375） m 及び n が共に1である前記（1359）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1376） m が0、 n が1、 R^6 及び R^7 が同一又は異なっており、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記（1364）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1377） m が0、 n が1、 R^6 及び R^7 が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する5～7員環の飽和複素環基（該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。）である前記（1364）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1378） m 及び n が共に1である前記（1364）に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

（1379） m が0、 n が1、 R^6 及び R^7 が同一又は異

なって、水素原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基、カルバモイル基置換低級アルキル基、アダマンチル基置換低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1380) mが0、nが1、 R^6 及び R^7 が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく形成する5～7員環の飽和複素環基(該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい。)である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1381) m及びnが共に1である前記(1369)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩。

【0168】(1382) R^1 が水素原子又はハロゲン原子である前記(1336)～(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1383) R^1 が低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル低級アルコキシ基である前記(1336)～(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1384) R^2 が基—(O)m—A—(CO)uNR⁶R⁷であり、 R^3 が水素原子である前記(1345)に記載のベンゾヘテロ環誘導体又はその塩

(1385) 5—[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]—1—[4-(4-メトキシフェニル)-2-メチルベンゾイル]—2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン

(1386) 5—[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]—1—(4-シクロヘキシル-2-メチルベンゾイル) —2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン

(1387) 5-イソプロピルアミノカルボニルメチル-1-(2-クロロ-4-ジメチルアミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン。

【0169】上記一般式(1)に示される各基はより具体的にはそれぞれ次の通りである。

【0170】低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ

基を例示できる。

【0171】低級アルキル基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【0172】ハロゲン原子としては、例えば弗素原子、塩素原子、臭素原子及び沃素原子が挙げられる。

【0173】低級アルカノイルオキシ基としては、例えばホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイルオキシ基を挙げることができる。

【0174】置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば2, 2, 2-トリフルオロアセチル、2, 2, 2-トリクロロアセチル、2-クロロアセチル、2-ブロモアセチル、2-フルオロアセチル、2-ヨードアセチル、2, 2-ジフルオロアセチル、2, 2-ジブロモアセチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピオニル、3, 3, 3-トリクロロプロピオニル、3-クロロプロピオニル、2, 3-ジクロロプロピオニル、4, 4, 4-トリクロロブチリル、4-フルオロブチリル、5-クロロペンタノイル、3-クロロ-2-メチルプロピオニル、6-プロモヘキサノイル、5, 6-ジブロモヘキサノイル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有していてもよい炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基を挙げることができる。

【0175】置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基としては、例えばアミノメトキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノペンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロポキシ、アセチルアミノメトキシ、1-アセチルアミノエトキシ、2-プロピオニルアミノエトキシ、3-イソプロピオニルアミノプロポキシ、4-ブチリルアミノブトキシ、5-ペンタノイルアミノペンチルオキシ、6-ヘキサノイルアミノヘキシルオキシ、ホルミルアミノメトキシ、メチルアミノメトキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロポキシ、4-ブチルアミノブトキシ、5-ペンチルアミノペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エトキシ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群より選ば

た基を1～2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0176】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0177】低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基としては、例えばメトキシカルボニルメトキシ、3-メトキシカルボニルプロポキシ、エトキシカルボニルメトキシ、3-エトキシカルボニルプロポキシ、4-エトキシカルボニルブトキシ、5-イソプロポキシカルボニルペンチルオキシ、6-プロポキシカルボニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエトキシ、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロポキシ、2-ペンチルオキシカルボニルエトキシ、ヘキシルオキシカルボニルメトキシ基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0178】カルボキシ基置換低級アルコキシ基としては、例えば、カルボキシメトキシ、2-カルボキシエトキシ、1-カルボキシエトキシ、3-カルボキシプロポキシ、4-カルボキシブトキシ、5-カルボキシペンチルオキシ、6-カルボキシヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-カルボキシエトキシ、2-メチル-3-カルボキシプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるカルボキシアルコキシ基を挙げることができる。

【0179】置換基として低級アルキル基を有するアミノカルボニル低級アルコキシ基としては、メチルアミノカルボニルメトキシ、1-エチルアミノカルボニルエトキシ、2-プロピルアミノカルボニルエトキシ、3-イソプロピルアミノカルボニルプロポキシ、4-ブチルアミノカルボニルブトキシ、5-ペンチルアミノカルボニルペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノカルボニルヘキシルオキシ、ジメチルアミノカルボニルメトキシ、3-ジエチルアミノカルボニルプロポキシ、ジエチルアミノカルボニルメトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)カルボニルメトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)カルボニルエトキシ基等の置換基として炭

素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有するアミノカルボニル基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0180】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-クロロベンゾイル、4-クロロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2-ブロモベンゾイル、3-ブロモベンゾイル、4-ブロモベンゾイル、2-ヨードベンゾイル、3-ヨードベンゾイル、4-ヨードベンゾイル、3, 4-ジクロロベンゾイル、2, 6-ジクロロベンゾイル、2, 3-ジクロロベンゾイル、2, 4-ジクロロベンゾイル、3, 4-ジフルオロベンゾイル、3, 5-ジブロモベンゾイル、3, 4, 5-トリクロロベンゾイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0181】カルボキシ置換低級アルキル基としては、例えばカルボキシメチル、2-カルボキシエチル、1-カルボキシエチル、3-カルボキシプロピル、4-カルボキシブチル、5-カルボキシペンチル、6-カルボキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルボキシエチル、2-メチル-3-カルボキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルボキシアルキル基を挙げることができる。

【0182】低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基としては、例えばメトキシカルボニルメチル、3-メトキシカルボニルプロピル、エトキシカルボニルメチル、3-エトキシカルボニルプロピル、4-エトキシカルボニルブチル、5-イソプロポキシカルボニルペンチル、6-プロポキシカルボニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエチル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロピル、2-ペンチルオキシカルボニルエチル、ヘキシルオキシカルボニルメチル基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルキル基を挙げることができる。

【0183】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基としては、例えば、2-アミノアセチルオキシ、3-アミノプロピオニルオキシ、2-アミノプロピオニルオキシ、4-アミノブチリルオキシ、2, 2-ジメチル-3-アミノプロピオニルオキシ、5-アミノペンタノイルオキシ、6-アミノヘキサノイルオキシ、2-メチル-3-アミノプロピオニルオキシ、2-メチルアミノアセチルオキシ、3-エチルアミノプロピオニルオキシ、2-プロピルアミノプロピオニルオキシ、4-イソプロピルアミノブチリルオキシ、4-ブチルアミノブチリルオキシ、4-tert-ブチルアミノブチリルオキシ、5-ペンチ

ルアミノペンタノイルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキサノイルオキシ、2-ジメチルアミノアセチルオキシ、3-ジエチルアミノプロピオニルオキシ、2-ジメチルアミノプロピオニルオキシ、2-(N-エチル-N-プロピルアミノ)アセチルオキシ、3-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)プロピオニルオキシ基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基を例示できる。

【0184】低級アルカノイル基としては、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基が挙げられる。

【0185】低級アルキリデン基としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0186】低級アルコキシカルボニル置換低級アルキリデン基としては、例えばエトキシカルボニルメチリデン、2-メトキシカルボニルエチリデン、3-イソプロポキシカルボニルプロピリデン、2-プロポキシカルボニルイソプロピリデン、4-ブトキシカルボニルブチリデン、5-ペンチルオキシカルボニルペンチリデン、6-ヘキシルオキシカルボニルヘキシリデン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0187】低級アルコキシ置換低級アルキリデン基としては、例えば、メトキシメチリデン、2-エトキシエチリデン、3-プロポキシプロピリデン、2-イソプロポキシイソプロピリデン、4-ブトキシブチリデン、5-ペンチルオキシペンチリデン、6-ヘキシルオキシヘキシリデン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0188】フェニル置換低級アルキリデン基としては、例えばフェニルメチリデン、2-フェニルエチリデン、3-フェニルプロピリデン、2-フェニルプロピリデン、4-フェニルブチリデン、5-フェニルペンチリデン、6-フェニルヘキシリデン基等のフェニル置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキリデン基を例示できる。

【0189】低級アルキレン基としては、例えばメチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等の炭素数1

~6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

【0190】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1,1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、メチルアミノメチル、1-エチルアミノエチル、2-プロピルアミノエチル、3-イソプロピルアミノプロピル、4-ブチルアミノブチル、5-ペンチルアミノペンチル、6-ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノメチル、2-ジエチルアミノエチル、2-ジメチルアミノエチル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0191】 R^6 及び R^7 又は R^B 及び R^C が結合する窒素原子と共に、窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する5~7員環の飽和複素環基としては、例えばピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、ホモピペラジニル基等を例示できる。

【0192】低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換した上記複素環基としては、例えば、4-メチルピペラジニル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3,4,5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-エチルホモピペラジニル、4-メチルホモピペラジニル、4-ヘキシルピペラジニル、4-ジフェニルメチルピペラジニル、4-ベンジルピペラジニル、3-メチル-4-ベンジルピペラジニル、3-(2-フェニルエチル)ピロリジニル、2-(1-フェニルエチル)ピロリジニル、4-(3-フェニルプロピル)ピペリジニル、3-(4-フェニルブチル)モルホリノ、3-(5-フェニルペンチル)ピペリジニル、4-(6-フェニルヘキシル)ピペラジニル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル基を1~2個有するアルキル基なる群から選ばれた基が1~3個置換した上記複素環基を例示できる。

【0193】低級アルキル基が置換した上記複素環基としては、例えば、4-メチルピペラジニル、3,4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3,4,5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-メチルホモピペラジニル、4-ヘキシルピペラジニル基等の炭素数1~6

の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が1～3個置換した上記複素環基を例示できる。

【0194】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-プロピルフェニル、4-ブチルフェニル、2-ペンチルフェニル、3-ヘキシルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0195】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-プロポキシフェニル、4-ブトキシフェニル、2-ペンチルオキシフェニル、3-ヘキシルオキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジエトキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0196】ピリジン環上に置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基としては、例えば、ピリジルカルボニル、2-フェニルピリジルカルボニル、3-フェニルピリジルカルボニル、4-フェニルピリジルカルボニル、2-(2-メチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-エチルフェニル)ピリジルカルボニル、4-(3-プロピルフェニル)ピリジルカルボニル、2-(4-ブチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-ペンチルフェニル)ピリジルカルボニル、4-(3-ヘキシルフェニル)ピリジルカルボニル、2-(3, 4-ジメチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)ピリジルカルボニル、3-(2-ピリジル)ピリジルカルボニル、2-(3-ピリジル)ピリジルカルボニル、4-(4-ピリジル)ピリジルカルボニル基等のピリジン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニル基及びピリジル基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基を例示できる。

【0197】フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-

フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、2-クロロベンジル、2-(3-クロロフェニル)エチル、2-フルオロベンジル、1-(4-クロロフェニル)エチル、3-(2-フルオロフェニル)プロピル、4-(3-フルオロフェニル)ブチル、5-(4-フルオロフェニル)ペンチル、1, 1-ジメチル-2-(2-ブロモフェニル)エチル、6-(3-ブロモフェニル)ヘキシル、4-ブロモベンジル、2-(2-ヨードフェニル)エチル、1-(3-ヨードフェニル)エチル、3-(4-ヨードフェニル)プロピル、3, 4-ジクロロベンジル、3, 5-ジクロロベンジル、2, 6-ジクロロベンジル、2, 3-ジクロロベンジル、2, 4-ジクロロベンジル、3, 4-ジフルオロベンジル、3, 5-ジブロモベンジル、3, 4, 5-トリクロロベンジル、3, 5-ジクロロ-4-ヒドロキシベンジル、3, 5-ジメチル-4-ヒドロキシベンジル、2-メトキシ-3-クロロベンジル、2-メチルベンジル、2-(2-メチルフェニル)エチル、1-(3-メチルフェニル)エチル、3-(4-メチルフェニル)プロピル、4-(2-エチルフェニル)ブチル、5-(3-プロピルフェニル)ペンチル、6-(4-ブチルフェニル)ヘキシル、2-(2-ペンチルフェニル)エチル、1-(3-ヘキシルフェニル)エチル、3-(3, 4-ジメチルフェニル)プロピル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)エチル、(2-メチル-6-クロロフェニル)メチル、3-フェニル-2-ヒドロキシプロピル、2-フェニル-2-ヒドロキシエチル、1-フェニル-1-ヒドロキシメチル、3-(4-メチルフェニル)-3-ヒドロキシプロピル、4-(3-クロロフェニル)-4-ヒドロキシブチル、5-(2-ブロモフェニル)-5-ヒドロキシペンチル、6-(4-フルオロフェニル)-6-ヒドロキシヘキシル基等のアルキル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、該アルキル基部分に水酸基を有することのある、且つフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

【0198】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基としては、例えばフェノキシメチル、2-フェノキシエチル、1-フェノキシエチル、4-フェノキシブチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエチル、2-メチル-3-フェノキシプロピル、(2-メチルフェノキシ)メチル、2-(2-メチルフェノキシ)エチル、3-フェノキシプロピル、4-(3-メチルフェノキシ)ブチル、5-(2-エチルフェノキシ)ペンチル、6-(3-プロピ

ルフェノキシ) ヘキシル、(4-ブチルフェノキシ) メチル、2-(2-ペンチルフェノキシ) エチル、1-(3-ヘキシルフェノキシ) エチル、3-(3, 4-ジメチルフェノキシ) プロピル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) エチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるフェノキシ基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0199】フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェノキシアセチル、2-フェノキシプロピオニル、3-フェノキシプロピオニル、2-フェノキシブチリル、4-フェノキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-フェノキシプロピオニル、5-フェノキシペンタノイル、6-フェノキシヘキサノイル、2-(2-クロロフェノキシ) アセチル、2-(3-クロロフェノキシ) アセチル、2-(4-クロロフェノキシ) アセチル、2-(2-フルオロフェノキシ) アセチル、2-(3-フルオロフェノキシ) アセチル、3-(4-フルオロフェノキシ) プロピオニル、2-(2-ブromoフェノキシ) プロピオニル、4-(3-ブromoフェノキシ) ブチリル、5-(4-ブromoフェノキシ) ペンタノイル、6-(2-ヨードフェノキシ) ヘキサノイル、2-(3-ヨードフェノキシ) アセチル、3-(4-ヨードフェノキシ) プロピオニル、4-(3, 4-ジクロロフェノキシ) ブチリル、2-(3, 4-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(2, 6-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(2, 3-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジクロロフェノキシ) アセチル、2-(3, 4-ジフルオロフェノキシ) アセチル、3-(3, 5-ジブromoフェノキシ) プロピオニル、2-(3, 4, 5-トリクロロフェノキシ) アセチル、2-(2-メチルフェノキシ) アセチル、2-(3-メチルフェノキシ) アセチル、2-(4-メチルフェノキシ) アセチル、3-(2-エチルフェノキシ) プロピオニル、2-(3-エチルフェノキシ) プロピオニル、4-(4-エチルフェノキシ) ブチリル、5-(4-イソプロピルフェノキシ) ペンタノイル、6-(3-ブチルフェノキシ) ヘキサノイル、3-(4-ペンチルフェノキシ) プロピオニル、2-(4-ヘキシルフェノキシ) アセチル、2-(3, 4-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(3, 4-ジエチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 5-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 6-ジメチルフェノキシ) アセチル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) アセチル、2-(3-クロロ-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(3-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-(3-ニトロフェノキシ) アセチル、2-(2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(3-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(4-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニルフェノキシ) アセチル、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) アセチル、3-(2-アミノフェノキシ) プロピオニル、4-(4-エチルアミノフェノキシ) ブチリル、5-(2, 3-ジメトキシフェノキシ) ペンタノイル、6-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ヘキサノイル、3-(2-エトキシフェノキシ) プロピオニル、4-(3-プロポキシフェノキシ) プロピオニル、2-(4-ブトキシフェノキシ) アセチル、3-(4-ペンチルオキシフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ヘキシルオキシフェノキシ) ブチリル、3-(2-ニトロフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ニトロフェノキシ) ブチリル、3-(3-フェニルフェノキシ) プロピオニル、4-(4-フェニルフェノキシ) ブチリル、5-[3-(2, 2, 2-トリクロロエチル) フェノキシ] ペンタノイル、6-[4-(5-ブromoヘキシル) フェノキシ] ヘキサノイル、2-(4-フェニル-2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニル-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 4, 6-トリニトロフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジニトロフェノキシ) アセチル、2-(3-フェニル-2-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-フェノキシ-2, 2-ジフルオロアセチル、3-(3-ジメチルアミノフェノキシ)-3-ブromoプロピオニル、4-(3-ニトロフェノキシ)-3, 4, 4-トリクロロブチリル、5-(2-メトキシフェノキシ)-5-ヨードペンタノイル、2-(2, 6-ジクロロフェノキシ)-2-クロロアセチル、2-(4-メチルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、2-(2-フェニルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、6-(2-フェニルフェノキシ)-6-ブromoヘキサノイル、2-(2-アセチルアミノフェノキシ) アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、ニトロ基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を1~3個有することのあるアルカノイル部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのあるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

ル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) アセチル、2-(3-クロロ-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(3-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-(3-ニトロフェノキシ) アセチル、2-(2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(3-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(4-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニルフェノキシ) アセチル、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) アセチル、3-(2-アミノフェノキシ) プロピオニル、4-(4-エチルアミノフェノキシ) ブチリル、5-(2, 3-ジメトキシフェノキシ) ペンタノイル、6-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ヘキサノイル、3-(2-エトキシフェノキシ) プロピオニル、4-(3-プロポキシフェノキシ) プロピオニル、2-(4-ブトキシフェノキシ) アセチル、3-(4-ペンチルオキシフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ヘキシルオキシフェノキシ) ブチリル、3-(2-ニトロフェノキシ) プロピオニル、4-(4-ニトロフェノキシ) ブチリル、3-(3-フェニルフェノキシ) プロピオニル、4-(4-フェニルフェノキシ) ブチリル、5-[3-(2, 2, 2-トリクロロエチル) フェノキシ] ペンタノイル、6-[4-(5-ブromoヘキシル) フェノキシ] ヘキサノイル、2-(4-フェニル-2-メトキシフェノキシ) アセチル、2-(2-フェニル-4-メチルフェノキシ) アセチル、2-(2, 4, 6-トリニトロフェノキシ) アセチル、2-(2, 4-ジニトロフェノキシ) アセチル、2-(3-フェニル-2-ジメチルアミノフェノキシ) アセチル、2-フェノキシ-2, 2-ジフルオロアセチル、3-(3-ジメチルアミノフェノキシ)-3-ブromoプロピオニル、4-(3-ニトロフェノキシ)-3, 4, 4-トリクロロブチリル、5-(2-メトキシフェノキシ)-5-ヨードペンタノイル、2-(2, 6-ジクロロフェノキシ)-2-クロロアセチル、2-(4-メチルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、2-(2-フェニルフェノキシ)-2, 2-ジフルオロアセチル、6-(2-フェニルフェノキシ)-6-ブromoヘキサノイル、2-(2-アセチルアミノフェノキシ) アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を1~3個有することのあるアルカノイル部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのあるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

【0200】置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル、N-エチル-N-（ピリジルメチル）アミノカルボニル、N-エチル-N-ベンジルアミノカルボニル、ベンジルアミノカルボニル、（2-フェニルエチル）アミノカルボニル、（1-フェニルエチル）アミノカルボニル、（3-フェニルプロピル）アミノカルボニル、（4-フェニルブチル）アミノカルボニル、（5-フェニルペンチル）アミノカルボニル、（6-フェニルヘキシル）アミノカルボニル、N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル、ピリジルメチルアミノカルボニル、（2-ピリジルエチル）アミノカルボニル、（3-ピリジルプロピル）アミノカルボニル、（4-ピリジルブチル）アミノカルボニル、（5-ピリジルペンチル）アミノカルボニル、（6-ピリジルヘキシル）アミノカルボニル、N-（ピリジルメチル）-N-ベンジルアミノカルボニル、N-メチル-N-（ピリジルメチル）アミノカルボニル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基及びアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0201】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-メチルベンゾイル、3-メチルベンゾイル、4-メチルベンゾイル、2-エチルベンゾイル、3-プロピルベンゾイル、4-ブチルベンゾイル、2-ペンチルベンゾイル、3-ヘキシルベンゾイル、3,4-ジメチルベンゾイル、3,4,5-トリメチルベンゾイル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0202】シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基等の炭素数3～8のシクロアルキル基を例示できる。

【0203】低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を例示できる。

【0204】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、2,2-ジメチル-3-フェニルプロピオニル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、2-（2-メチルフェニル）アセチル、2-（3-メチルフェニル）アセチル、2-（4-メチルフェニル）アセチル、3-（2-エチルフェニル）プロピオニル、2-（3-エチルフェニル）プロピオニル、4-（4-エチルフェニル）ブチリル、5-（4-イソプロピルフェニル）ペンタノイル、6-（3-ブチルフェニル）ヘキサノイル、3-（4-ペンチルフェニル）プロピオニル、2-（4-ヘキシルフェニル）アセチル、2-（3,4-ジメチルフェニル）アセチル、2-（3,4-ジエチルフェニル）アセチル、2-（2,4-ジメチルフェニル）アセチル、2-（2,5-ジメチルフェニル）アセチル、2-（2,6-ジメチルフェニル）アセチル、2-（3,4,5-トリメチルフェニル）アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェニルアルカノイル基を例示できる。

【0205】ハロゲン原子置換低級アルコキシ基としては、例えば、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジプロモメトキシ、2-クロロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、4,4,4-トリクロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロベンチルオキシ、3-クロロ-2-メチルプロポキシ、5-プロモヘキシルオキシ、5,6-ジクロロヘキシルオキシ基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0206】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基としては、例えば、アミノメトキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノペンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロポキシ、メチルアミノメトキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロポキシ、4-イソプロピルア

ミノプトキシ、4-ブチルアミノプトキシ、4-tert-ブチルアミノプトキシ、5-ペンチルアミノペンチルオキシ、6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、2-ジエチルアミノエトキシ、2-ジメチルアミノエトキシ、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メトキシ、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エトキシ等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0207】フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-プロピルフェニル、4-ブチルフェニル、2-ペンチルフェニル、3-ヘキシルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,4,5-トリメチルフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、3-プロポキシフェニル、4-プロポキシフェニル、4-ブトキシフェニル、2-ペンチルオキシフェニル、3-ヘキシルオキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、3,4-ジエトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、2,4-ジヒドロキシフェニル、3,4-ジヒドロキシフェニル、2,4,6-トリヒドロキシフェニル、2-アセチルオキシフェニル、3-プロピオニルオキシフェニル、2-ベンジルオキシフェニル、3-ベンジルオキシフェニル、4-ベンジルオキシフェニル、2-(2-フェニルエトキシ)フェニル、3-(3-フェニルプロポキシ)フェニル、4-(4-フェニルブトキシ)フェニル、3-(1-フェニルエトキシ)フェニル、2-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル、2,4-ジベンジルオキシフェニル、3,4-ジベンジルオキシフェニル、3,4,5-トリベンジルオキシフェニル、4-ブチルオキシフェニル、2-ペンタノイルオキシフェニル、4-ヘキサノイルオキシフェニル、2,4-ジアセチルオキシフェニル、2,6-ジアセチルオキシフェニル、3,4,5-トリアセチルオキシフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3-(2-クロロエトキシ)フェニル、2-(3-プロモプロポキシ)フェニル、4-ヨードメトキシフェニル、2-(2,3-ジクロプロポキシ)フェニル、3-(4-

-フルオロプトキシ)フェニル、4-(3-クロロ-2-メチルプロポキシ)フェニル、2-(5-プロモヘキシルオキシ)フェニル、3-(5,6-ジクロロヘキシルオキシ)フェニル、4-(2,2,2-トリクロロエトキシ)フェニル、2,4-ビストリフルオロメトキシフェニル、2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル、2-アミノメトキシフェニル、3-(1-アミノエトキシ)フェニル、4-(3-アミノプロポキシ)フェニル、2-(4-アミノプトキシ)フェニル、3-(5-アミノペンチルオキシ)フェニル、4-(6-アミノヘキシルオキシ)フェニル、2-メチルアミノメトキシフェニル、3-(2-プロピルアミノエトキシ)フェニル、2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ)フェニル、4-(4-ブチルアミノプトキシ)フェニル、2-(5-ペンチルアミノペンチルオキシ)フェニル、3-(6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ)フェニル、4-ジメチルアミノメトキシフェニル、2-(N-エチル-N-プロピルアミノメトキシ)フェニル、2-メチル-4-メトキシフェニル、2-メチル-6-ヒドロキシフェニル、4-メチル-2-(3-プロモプロポキシ)フェニル、4-メトキシ-2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ)フェニル、2-フェニルフェニル、3-フェニルフェニル、4-フェニルフェニル、2-ニトロフェニル、3-ニトロフェニル、4-ニトロフェニル、2,3-ジニトロフェニル、2,4,6-トリニトロフェニル、2-アミノエチル、3-アミノフェニル、4-アミノフェニル、2,4-ジアミノフェニル、3,4,5-トリアミノフェニル、4-アセチルアミノフェニル、2-プロピオニルアミノフェニル、3-ブチルアミノフェニル、4-ペンタノイルアミノフェニル、4-ヘキサノイルアミノフェニル、2,3-ジアセチルアミノフェニル、2,4,6-トリアセチルアミノフェニル等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、水酸基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基、及び置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0208】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノ低級アルキル基としては、例えば、アニリノメチル、2-アニリノエチル、1-アニリノエチル、3-アニリノプロピル、4-アニリノブチル、1,1-ジメチル-2-アニリノエチル、5-アニリノペンチル、6-アニリノヘキシル、2-メチ-

ル-3-アニリノプロピル、(2-メチルアニリノ)メチル、2-(2-メチルアニリノ)エチル、1-(3-メチルアニリノ)エチル、3-(4-メチルアニリノ)プロピル、4-(2-エチルアニリノ)ブチル、5-(3-プロピルアニリノ)ペンチル、6-(4-ブチルアニリノ)ヘキシル、2-(2-ペンチルアニリノ)エチル、1-(3-ヘキシルアニリノ)エチル、3-(3, 4-ジメチルアニリノ)プロピル、2-(3, 4, 5-トリメチルアニリノ)エチル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるアニリノアルキル基を例示できる。

【0209】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、例えば、フェニルメトキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ、(2-クロロフェニル)メトキシ、(2-ブromoフェニル)メトキシ、2-(4-フルオロフェニル)エトキシ、1-(4-ブromoフェニル)エトキシ、3-(3-ブromoフェニル)プロポキシ、4-(4-クロロフェニル)ブトキシ、5-(2-ヨードフェニル)ペンチルオキシ、6-(3-ヨードフェニル)ヘキシルオキシ、(2, 6-ジクロロフェニル)メトキシ、(2, 3-ジクロロフェニル)メトキシ、(2, 4-ジクロロフェニル)メトキシ、(3, 4-ジフルオロフェニル)メトキシ、(3, 4, 5-トリクロロフェニル)メトキシ、(2-メトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(3-エトキシカルボニルフェニル)メトキシ、2-(4-イソプロポキシカルボニルフェニル)エトキシ、3-(2-プトキシカルボニルフェニル)プロポキシ、4-(3-ペンチルオキシカルボニルフェニル)ブトキシ、5-(4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシ、6-(2-メトキシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシ、(2, 4-ジメトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(2, 4, 6-トリエトキシカルボニルフェニル)メトキシ、(2-カルバモイルフェニル)メトキシ、2-(3-メチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、1-(4-エチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、3-(2-イソプロピルアミノカルボニルフェニル)プロポキシ、4-(3-ブチルアミノカルボニルフェニル)ブトキシ、5-(4-ペンチルアミノカルボニルフェニル)ペンチルオキシ、6-

(2-ヘキシルアミノカルボニルフェニル)ヘキシルオキシ、(2-ジメチルアミノカルボニルフェニル)メトキシ、2-(3-ジブチルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、1-(4-ジヘキシルアミノカルボニルフェニル)エトキシ、3-[2-(N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、(2-アミノメチルアミノカルボニルフェニル)メトキシ、2-[3-(2-アミノエチルアミノカルボニル)フェニル]エトキシ、3-[4-(3-アミノプロピルアミノカルボニル)フェニル]プロポキシ、4-[2-(4-アミノブチルアミノカルボニル)フェニル]ブトキシ、5-[3-(5-アミノペンチルアミノカルボニル)フェニル]ペンチルオキシ、6-[4-(6-アミノヘキシルアミノカルボニル)フェニル]ヘキシルオキシ、[2-(N-メチル-N-メチルアミノメチル)アミノカルボニルフェニル]メトキシ、2-[3-(3-イソプロピルアミノプロピルアミノカルボニル)フェニル]エトキシ、3-[4-[N-プロピル-N-(5-ペンチルアミノペンチル)アミノカルボニル]フェニル]プロポキシ、{2-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル]フェニル}メトキシ、{2-[N, N-ビス(ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル]フェニル}メトキシ、4-[3-(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチルアミノカルボニルフェニル]ブトキシ、5-[4-{N-[2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル]-N-エチルアミノカルボニル}フェニル]ペンチルオキシ、6-{4-クロロ-2-[N-ブチル-N-(6-ヘキシルアミノヘキシル)アミノカルボニル]フェニル}ヘキシルオキシ、[2-ブromo-4-(N-ヘキシル-N-ジメチルアミノメチル)アミノカルボニルフェニル]メトキシ、(2-メトキシカルボニル-3-クロロフェニル)メトキシ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基並びに置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を1~3個有することがあり、且つアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を例示できる。

【0210】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンゾイルメトキシ、2-ベンゾイルエトキシ、1-ベンゾイルエトキシ、3-ベンゾイルプロポキシ、4-ベンゾイルブトキシ、5-ベンゾイルヘキシルオキシ、6-ベンゾイルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエトキシ、2-メチル-3-ベ

ンゾイルプロボキシ、2-（2-クロロベンゾイル）エトキシ、1-（3-クロロベンゾイル）エトキシ、（4-クロロベンゾイル）メトキシ、3-（2-フルオロベンゾイル）プロボキシ、4-（3-フルオロベンゾイル）ブトキシ、5-（4-フルオロベンゾイル）ペンチロキシ、6-（2-ブロモベンゾイル）ヘキシロキシ、1, 1-ジメチル-2-（3-ブロモベンゾイル）エトキシ、2-メチル-3-（4-ブロモベンゾイル）プロボキシ、（2-ヨードベンゾイル）メトキシ、2-（3-ヨードベンゾイル）エトキシ、3-（4-ヨードベンゾイル）プロボキシ、4-（3, 4-ジクロロベンゾイル）ブトキシ、5-（2, 6-ジクロロベンゾイル）ペンチロキシ、6-（2, 3-ジクロロベンゾイル）ヘキシロキシ、（2, 4-ジクロロベンゾイル）メトキシ、（3, 4-ジフルオロベンゾイル）メトキシ、（3, 5-ジブロモベンゾイル）メトキシ、（3, 4, 5-トリクロロベンゾイル）メトキシ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、且つアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるベンゾイルアルコキシ基を例示できる。

【0211】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニル基としては、例えばスチリル、3-フェニル-2-プロペニル、3-フェニル-1-プロペニル、4-フェニル-3-ブテニル、4-フェニル-2-ブテニル、4-フェニル-1-ブテニル、5-フェニル-4-ペンテニル、5-フェニル-3-ペンテニル、5-フェニル-2-ペンテニル、5-フェニル-1-ペンテニル、1-メチル-3-フェニル-2-ブテニル、6-フェニル-5-ヘキセニル、1-メチルスチリル、2-, 3-もしくは4-クロロスチリル、3-（4-ブロモフェニル）-2-プロペニル、3-（3-フルオロフェニル）-1-プロペニル、4-（4-ヨードフェニル）-3-ブテニル、5-（2-クロロフェニル）-4-ペンテニル、2-メチル-3-プロモスチリル、3, 4-ジクロロスチリル、3, 4, 5-トリクロロスチリル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのあるフェニル基を有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

【0212】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基としては、例えば、ベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル、（2-メチルベンゾイル）メチル、2-（2-メチルベンゾイル）エチル、1-（3-メチルベンゾイル）エチル、3-（4-メチルベンゾイル）プロピル、4-（2-エ

チルベンゾイル）ブチル、5-（3-プロピルベンゾイル）ペンチル、6-（4-ブチルベンゾイル）ヘキシル、2-（2-ペンチルベンゾイル）エチル、1-（3-ヘキシルベンゾイル）エチル、3-（3, 4-ジメチルベンゾイル）プロピル、2-（3, 4, 5-トリメチルベンゾイル）エチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるベンゾイルアルキル基を例示できる。

【0213】ピロリジニル置換低級アルコキシ基としては、例えば、（2-ピロリジニル）メトキシ、2-（2-ピロリジニル）エトキシ、1-（3-ピロリジニル）エトキシ、3-（2-ピロリジニル）プロボキシ、4-（3-ピロリジニル）ブトキシ、5-（2-ピロリジニル）ペンチロキシ、6-（3-ピロリジニル）ヘキシロキシ、1, 1-ジメチル-2-（2-ピロリジニル）エトキシ、2-メチル-3-（3-ピロリジニル）プロボキシ、5-（1-ピロリジニル）ペンチロキシ、2-（1-ピロリジニル）エトキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるピロリジニルアルコキシ基を例示できる。

【0214】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチルベンジル、2-（2-メチルフェニル）エチル、1-（3-メチルフェニル）エチル、3-（4-メチルフェニル）プロピル、4-（2-エチルフェニル）ブチル、5-（3-プロピルフェニル）ペンチル、6-（4-ブチルフェニル）ヘキシル、2-（2-ペンチルフェニル）エチル、1-（3-ヘキシルフェニル）エチル、3-（3, 4-ジメチルフェニル）プロピル、2-（3, 4, 5-トリメチルフェニル）エチル、（2-メチル-6-クロロフェニル）メチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

【0215】低級アルコキシカルボニル基としては、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロボキシカルボニル、イソプロボキシカルボニル、ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ペンチロキシカルボニル、ヘキシロキシカルボニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0216】置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級

アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル、アミノメチルアミノカルボニル、2-アミノエチルアミノカルボニル、1-アミノエチルアミノカルボニル、3-アミノプロピルアミノカルボニル、4-アミノブチルアミノカルボニル、5-アミノペンチルアミノカルボニル、6-アミノヘキシルアミノカルボニル、1, 1-ジメチル-2-アミノエチルアミノカルボニル、2-メチル-3-アミノプロピルアミノカルボニル、メチルアミノメチルアミノカルボニル、1-エチルアミノエチルアミノカルボニル、2-プロピルアミノエチルアミノカルボニル、3-イソプロピルアミノプロピルアミノカルボニル、4-ブチルアミノブチルアミノカルボニル、5-ペンチルアミノペンチルアミノカルボニル、6-ヘキシルアミノヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノメチルアミノカルボニル、2-ジエチルアミノエチルアミノカルボニル、2-ジメチルアミノエチルアミノカルボニル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチルアミノカルボニル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチルアミノカルボニル、N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノカルボニル、N-エチル-N-(メチルアミノメチル)アミノカルボニル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0217】置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基としては、例えば前記低級アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5, 5, 4-トリヒドロキシペンチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、1-ヒドロキシイソプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基等の水酸基を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0218】カルバモイル基低級アルキル基としては、例えばカルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルバモイルアルキル基を例示できる。

【0219】アダマンチル基置換低級アルキル基としては、例えばアダマンチルメチル、2-アダマンチルエチル、1-アダマンチルエチル、3-アダマンチルプロピル、4-アダマンチルブチル、5-アダマンチルペンチル、6-アダマンチルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アダマンチルエチル、2-メチル-3-アダマンチルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアダマンチルアルキル基を例示できる。

【0220】低級アルキルスルホニル基としては、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、tert-ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、ヘキシルスルホニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0221】水酸基置換低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5, 5, 4-トリヒドロキシペンチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、1-ヒドロキシイソプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基等の水酸基を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0222】フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、2-メチル-3-フェニルプロピル、ジフェニルメチル、2, 2-ジフェニルエチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル基を1～2個有するアルキル基を挙げることができる。

【0223】キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基としては、例えばキノリルカルボニル、2-フェニルキノリルカルボニル、3-フェニルキノリルカルボニル、4-フェニルキノリルカルボニル、5-フェニルキノリルカルボニル、6-フェニルキノリルカルボニル、7-フェニルキノリルカルボニル、8-フェニルキノリルカルボニル基等の

キノリン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるキノリルカルボニル基を例示できる。

【0224】チオフエン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基としては、例えばチエニルカルボニル、2-フェニルチエニルカルボニル、3-フェニルチエニルカルボニル、4-フェニルチエニルカルボニル基等のチオフエン環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチエニルカルボニル基を例示できる。

【0225】チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基としては、例えばチアゾリルカルボニル、2-フェニルチアゾリルカルボニル、4-フェニルチアゾリルカルボニル、5-フェニルチアゾリルカルボニル基等のチアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリルカルボニル基を例示できる。

【0226】シクロアルキルカルボニル基としては、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル基等の炭素数3～8のシクロアルキルカルボニル基を例示できる。

【0227】置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば前記置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基に加えて、2-ヒドロキシアセチル、3-ヒドロキシプロピオニル、2-ヒドロキシプロピオニル、4-ヒドロキシブチリル、5-ヒドロキシペンタノイル、6-ヒドロキシヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-ヒドロキシプロピオニル等の置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0228】ハロゲン原子置換低級アルキル基としては、例えばトリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、2-クロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-プロモプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、4, 4, 4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-プロモヘキシル、5, 6-ジクロロヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0229】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミ

ノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0230】置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基としては、例えば前記低級アルコキシカルボニル基に加えて、トリフルオロメトキシカルボニル、トリクロロメトキシカルボニル、クロロメトキシカルボニル、プロモメトキシカルボニル、フルオロメトキシカルボニル、ヨードメトキシカルボニル、ジフルオロメトキシカルボニル、ジプロモメトキシカルボニル、2-クロロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、3-プロモプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、4, 4, 4-トリクロロプロポキシカルボニル、4-フルオロプロポキシカルボニル、5-クロロペンチルオキシカルボニル、3-クロロ-2-メチルプロポキシカルボニル、5-プロモヘキシルオキシカルボニル、5, 6-ジクロロヘキシルオキシカルボニル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することもある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0231】低級アルコキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-メトキシアセチル、3-メトキシプロピオニル、2-エトキシアセチル、3-エトキシプロピオニル、4-エトキシブチリル、3-プロポキシプロピオニル、2-メトキシプロピオニル、6-プロポキシヘキサノル、5-イソプロポキシペンタノル、2, 2-ジメチル-3-ブトキシプロピオニル、2-メチル-3-tert-ブトキシプロピオニル、2-ペンチルオキシアセチル、2-ヘキシルオキシアセチル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコシアルカノイル基を挙げることができる。

【0232】低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-アセチルオキシアセチル、3-アセチルオキシプロピオニル、2-プロピオニルオキシアセチル、3-プロピオニルオキシプロピオニル、4-プロピオニルオキシブチリル、3-ブチルオキシプロピオニル、2-アセチルオキシプロピオニル、6-プロピオニルオキシヘキサノイル、5-ブチルオキシペンタノイル、2, 2-ジメチル-3-ブチルオキシプロピオニル、2-ペンタノイルオキシアセチル、2-ヘキサノイルオキシアセチル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基である炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシア

ルカノイル基を挙げることができる。

【0233】キノリルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-キノリルオキシアセチル、3-キノリルオキシプロピオニル、2-キノリルオキシプロピオニル、4-キノリルオキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-キノリルオキシプロピオニル、5-キノリルオキシペンタノイル、6-キノリルオキシヘキサノイル基等のアルカノイル基部分の炭素数が2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるキノリルオキシアルカノイル基を例示できる。

【0234】フェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えばベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブトキシカルボニル、5-フェニルペンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフェニルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0235】ベンゾイル低級アルキル基としては、例えばベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾイルアルキル基を挙げることができる。

【0236】キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基としては、例えば2-テトラヒドロキノリルオキシアセチル、3-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、2-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、4-テトラヒドロキノリルオキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-テトラヒドロキノリルオキシプロピオニル、5-テトラヒドロキノリルオキシペンタノイル、6-テトラヒドロキノリルオキシヘキサノイル、2-（1-メチルテトラヒドロキノリルオキシ）アセチル、2-（2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）アセチル、3-（2-エチルテトラヒドロキノリルオキシ）プロピオニル、2-（3-プロピルテトラヒドロキノリルオキシ）プロピオニル、4-（4-ブチルテトラヒドロキノリルオキシ）ブチリル、2, 2-ジメチル-3-（5-ペンチルテトラヒドロキノリルオキシ）プロピオニル、5-（6-ヘキシルテトラヒドロキノリルオキシ）ペンタノイル、6-（7-メチルテトラヒドロキノリルオキシ）ヘキサノイル、2-（8-メチルテトラヒドロキノリルオキシ）アセチル、2-（1, 4-ジメチルテトラヒドロ

キノリルオキシ）アセチル、2-（2, 4, 6-トリメチルテトラヒドロキノリルオキシ）アセチル、2-（1-メチル-2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）アセチル、3-（2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）プロピオニル、4-（2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）ブチリル、5-（2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）ペンタノイル、6-（2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）ヘキサノイル、2-（1, 6-ジメチル-2-オキシテトラヒドロキノリルオキシ）アセチル基等のキノリン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ基が置換した炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0237】テトラヒドロナフチルオキシ低級アルカノイル基としては、例えば2-テトラヒドロナフチルオキシアセチル、3-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、2-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、4-テトラヒドロナフチルオキシブチリル、2, 2-ジメチル-3-テトラヒドロナフチルオキシプロピオニル、5-テトラヒドロナフチルオキシペンタノイル、6-テトラヒドロナフチルオキシヘキサノイル基等のアルカノイル部分の炭素数が2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるテトラヒドロナフチルオキシアルカノイル基を例示できる。

【0238】フェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えばシンナモイル、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル、3-フェニル-1-プロペニルカルボニル、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル、4-フェニル-1-ブテニルカルボニル、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-2-ペンテニルカルボニル、5-フェニル-1-ペンテニルカルボニル、1-メチル-3-フェニル-2-ブテニルカルボニル、1-メチルシンナモイル基等のアルケニルカルボニル部分が炭素数3～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルカルボニル基であるフェニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0239】シクロアルケニル基としては、例えばシクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル基等の炭素数3～8のシクロアルケニル基を例示できる。

【0240】フェニル低級アルキルアミノカルボニル基としては、例えばベンジルアミノカルボニル、（2-フェニルエチル）アミノカルボニル、（1-フェニルエチル）アミノカルボニル、（3-フェニルプロピル）アミノカルボニル、（4-フェニルブチル）アミノカルボニル、（5-フェニルペンチル）アミノカルボニル、（6-フェニルヘキシル）アミノカルボニル、（1, 1-ジ

メチル-2-フェニルエチル) アミノカルボニル、(2-メチル-3-フェニルプロピル) アミノカルボニル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキルアミノカルボニル基を挙げることができる。

【0241】窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する飽和又は不飽和の5から11員環の単環又は二項環の複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ペペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ピリジル、ホモピペラジニル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル、チエニル、キノリル、1, 4-ジヒドロキノリル、ベンゾチアゾリル、ピラジル、ピリミジル、ピリダジル、ピロリル、カルボスチリル、3, 4-ジヒドロカルボスチリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾリジニル、イソキノリル、キナゾリジニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、1, 2-ジヒドロイソキノリル、キノキサリニル、シンノリニル、フタラジニル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、クロマニル、イソインドリニル、イソクロマニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリジニル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、ベンゾフリル、2, 3-ジヒドロベンゾ〔b〕フリル、ベンゾチエニル、1-アザシクロヘプチル、4H-クロメニル、1H-インダゾリル、イソインドリニル、2-イミダゾリニル、2-ピロリニル、フリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、ピラゾリジニル、2-ピラゾリニル、キヌクリジニル、1, 4-ベンゾオキサジニル、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾオキサジニル、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾチアジニル、1, 4-ベンゾチアジニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリニル、1, 3-ジチア-2, 4-ジヒドロナフタレニル、テトラヒドロ-1, 3-オキサジニル、テトラヒドロオキサゾリル、1, 4-ジチアナフタレニル基等を例示できる。

【0242】低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有する前記複素環としては、例えば1-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、2-オキソピペリジニル、2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、2-オキソピロリジニル、5-フェニルチアゾリル、1-メチルイミダゾリル、1-プロピルイミダゾリル、4-メチルイミダゾリル、4-フェニルイミダゾリル、1, 4-ジメチルピロリル、4-メチルピペラジニル、4-フェニルピペリジニル、4-メチルチアゾリル、2-オキソチアゾリル、5-エチルチアゾリル、4-フェニルチアゾリル、4-プロピルチアゾリル、5-ブチルチアゾリル、4-ペンチルチアゾリル、2-ヘキシルチアゾリル、4, 5-

-ジメチルチアゾリル、5-フェニル-4-メチルチアゾリル、1-エチルイミダゾリル、4-プロピルイミダゾリル、5-ブチルイミダゾリル、1-ペンチルイミダゾリル、1-ヘキシルイミダゾリル、1, 4-ジメチルイミダゾリル、1, 4, 5-トリメチルイミダゾリル、1-フェニルイミダゾリル、2-フェニルイミダゾリル、5-フェニルイミダゾリル、1-メチル-4-フェニルイミダゾリル、3-メチル-1, 2, 4-トリアゾリル、5-エチル-1, 2, 4-トリアゾリル、3-フェニル-1, 2, 4-トリアゾリル、2-オキソ-1-メチルイミダゾリル、2-オキソイミダゾリル、2-エチルピロリル、3-プロピルピロリル、5-ブチルピロリル、4-ペンチルピロリル、2-ヘキシルピロリル、2, 4, 5-トリメチルピロリル、2-フェニルピロリル、2, 5-ジフェニルピロリル、2-メチル-5-フェニルピロリル、2-オキソピロリル、1-メチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-エチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-プロピル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-ブチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-ペンチル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-ヘキシル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラゾリル、2-メチルピリジル、3-エチルピリジル、4-プロピルピリジル、2-ブチルピリジル、3-ペンチルピリジル、4-ヘキシルピリジル、2-フェニルピリジル、3-フェニルピリジル、4-フェニルピリジル、2, 4-ジメチルピリジル、2, 4, 6-トリメチルピリジル、2-メチル-4-フェニルピリジル、2, 4-ジフェニルピリジル、2, 4, 6-トリフェニルピリジル、2-オキソピリジル、4-オキソピリジル、4-メチル-2-オキソピリジル、2-フェニル-4-オキソピリジル、3-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、4-エチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、3-フェニルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、5-フェニルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、3-メチル-1H-インダゾリル、3-フェニル-1H-インダゾリル、1-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、5-エチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、6-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、1-オキソ-6-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、1-オキソ-7-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル、3, 4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-プロピルピロリジニル、1-メチルピロリジニル、3, 4, 5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-ヘキシルピペラジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、4-ヘキシルピペラジニル、3-メチルチオモルホリノ、4-フェニルピペラジニル、3-フェニルピロリジニル、2-オ-

キソ-4-メチルピペリジニル、2-オキソ-3-メチルピロリジニル、2-オキソ-4-フェニルピペリジニル、4-メチル-1-アザシクロヘプチル、5-フェニル-1-アザシクロヘプチル、6-メチル-2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、1-メチル-2-オキソイミダゾリジニル、1-イソブチル-2-オキソイミダゾリジニル、1-ベンジル-2-オキソイミダゾリジニル、2-オキソテトラヒドロ-1, 3-オキサジニル、3-フェニル-2-オキソ-1-アザシクロヘプチル、2-オキソテトラヒドロオキサゾリル、3-クロロピリジニル、4-メチルピペラジニル、4-イソブチルピペラジニル、4-メチルホモピペラジニル、4-アセチルピペラジニル、4-ベンジルピペラジニル、4-エチルホモピペラジニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、フェニル基、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、ハロゲン原子、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルであるフェニルアルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基を1～3個有する前記複素環基を例示できる。

【0243】シアノ置換低級アルキル基としては、例えばシアノメチル、2-シアノエチル、1-シアノエチル、3-シアノプロピル、4-シアノブチル、5-シアノペンチル、6-シアノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-シアノエチル、2-メチル-3-シアノプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるシアノアルキル基を挙げることができる。

【0244】テトラゾリル基置換低級アルキル基としては、例えばテトラゾリルメチル、2-テトラゾリルエチル、1-テトラゾリルエチル、3-テトラゾリルプロピル、4-テトラゾリルブチル、5-テトラゾリルペンチル、6-テトラゾリルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-テトラゾリルエチル、2-メチル-3-テトラゾリルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラゾリルアルキル基を例示できる。

【0245】低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基としては、例えばアセチルオキシメチル、2-プロピオニルオキシエチル、1-ブチリルオキシエチル、3-アセチルオキシプロピル、4-アセチルオキシブチル、4-イソブチリルオキシブチル、5-ペンタノイルオキシペンチル、6-アセチルオキシヘキシル、6-tert-ブチルカルボニルオキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ヘキサノイルオキシエチル、2-メチル-3-アセチルオキシプロピル基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基置換炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0246】置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えばアミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリ

ルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を例示できる。

【0247】ピリジル低級アルキル基としては、例えば(4-ピリジル)メチル、1-(3-ピリジル)エチル、2-(2-ピリジル)エチル、3-(2-ピリジル)プロピル、4-(3-ピリジル)ブチル、5-(4-ピリジル)ペンチル、6-(2-ピリジル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(3-ピリジル)エチル、2-メチル-3-(4-ピリジル)プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を挙げることができる。

【0248】フェノキシ低級アルコキシカルボニル基としては、例えばフェノキシメトキシカルボニル、2-フェノキシエトキシカルボニル、1-フェノキシエトキシカルボニル、3-フェノキシプロポキシカルボニル、4-フェノキシブトキシカルボニル、5-フェノキシペンチルオキシカルボニル、6-フェノキシヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェノキシプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフェノキシアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0249】ピリジル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(4-ピリジル)メトキシカルボニル、(2-ピリジル)メトキシカルボニル、(3-ピリジル)メトキシカルボニル、2-(2-ピリジル)エトキシカルボニル、1-(1-ピリジル)エトキシカルボニル、3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル、4-(4-ピリジル)ブトキシカルボニル、5-(3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル、6-(2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル、基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるピリジルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0250】フルオレニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(5-フルオレニル)メトキシカルボニル、2-(2-フルオレニル)エトキシカルボニル、1-(1-フルオレニル)エトキシカルボニル、3-(3-フルオレニル)プロポキシカルボニル、4-(4-フルオレニル)ブトキシカルボニル、5-(5-フルオレニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(1-フルオレニル)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-(2-フルオレニル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(3-フルオレニル)プロポキシカルボ

ニル基等のアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるフルオレニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0251】低級アルケニルオキシカルボニル基としては、例えばビニルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、2-ブテニルオキシカルボニル、3-ブテニルオキシカルボニル、1-メチルアリルオキシカルボニル、2-ペンテニルオキシカルボニル、2-ヘキセニルオキシカルボニル基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシカルボニル基を例示できる。

【0252】ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば(4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、2-(3-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(2-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(4-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(3-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(2-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-(4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、2-メチル-3-(1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、(1-エチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、(1-t-ブトキシカルボニル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、(1-アセチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、2-(1-メチル-4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(4-プロピル-1-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-ブチル-3-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(3-ペンチル-2-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキシル-4-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、(1, 2-ジメチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル、(3, 4, 5-トリメチル-1-ピペリジニル)メトキシカルボニル、2-(1-メトキシカルボニル-4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(1-エトキシカルボニル-4-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-プロポキシカルボニル-1-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(3-ペンチルオキシカルボニル-2-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキシルオキシカルボニル-4-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(4-メトキシカルボニル-1-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、2-(2-アセチル-1-ピペリジニル)エトキシカルボニル、1-(3-プロピオニル-2-ピペリジニル)エトキシカルボニル、3-(4-ブチル-3-ピペリジニル)プロポキシカルボニル、4-(4-ペンタノイル-1-ピペリジニル)ブトキシカルボニル、5-(1-ヘキサノイル-4-ピペリジニル)ペンチルオキシカルボニル、6-(1-アセチル-2-

メチル-4-ピペリジニル)ヘキシルオキシカルボニル、(1-エトキシカルボニル-2, 6-ジメチル-4-ピペリジニル)メトキシカルボニル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるアルコキシカルボニル部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルであるピペリジニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0253】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノスルホンオキシ基としては、例えばアミノスルホンオキシ、メチルアミノスルホンオキシ、エチルアミノスルホンオキシ、プロピルアミノスルホンオキシ、イソプロピルアミノスルホンオキシ、ブチルアミノスルホンオキシ、tert-ブチルアミノスルホンオキシ、ペンチルアミノスルホンオキシ、ヘキシルアミノスルホンオキシ、ジメチルアミノスルホンオキシ、ジエチルアミノスルホンオキシ、ジプロピルアミノスルホンオキシ、ジブチルアミノスルホンオキシ、ジペンチルアミノスルホンオキシ、ジヘキシルアミノスルホンオキシ、N-メチル-N-エチルアミノスルホンオキシ、N-エチル-N-プロピルアミノスルホンオキシ、N-メチル-N-ブチルアミノスルホンオキシ、N-メチル-N-ヘキシルアミノスルホンオキシ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノスルホンオキシ基を例示できる。

【0254】フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

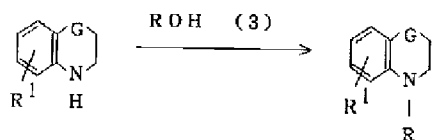
【0255】低級アルカノイル基置換アミノ基としては、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基置換アミノ基を例示できる。

【0256】本発明の化合物は、種々の方法により製造することができる。

【0257】

【化28】

反応式-1



【0258】⁽²⁾〔式中、G、R¹、R²、R³、~~R~~及びXは前記に同じ。〕

反応式-1で示される方法は、一般式(2)のベンゾヘテロ環化合物と一般式(3)のカルボン酸とを、通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。酸アミド結合生成反応には公知のアミド結合生成反応の条件を容易に適用できる。例えば(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(3)にアルキルハロ炭酸エステルを反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(2)を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(3)をp-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステルとし、これにアミン(2)を反応させる方法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(3)にアミン(2)をジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(3)を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(2)を反応させる方法、カルボン酸(3)と低級アルコールとのエステルにアミン(2)を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(3)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法等を挙げることができる。

【0259】上記混合酸無水物法(イ)において用いられる混合酸無水物は、通常の上記ショッテンーバウマン反応と同様の反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(2)と反応させることにより一般式(1)の本発明化合物が製造される。上記ショッテンーバウマン反応は塩基性化合物の存在下に行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、ショッテンーバウマン反応に慣用の化合物例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチル-2-ピロリジノン(NMP)、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基等が挙げられる。該反応は、通常-20~100℃程度、好ましくは0~50℃程度において行なわれ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~2時間程度である。得られた混合酸無水物とアミン(2)との反応は通常-20~150℃程度、好ま

しくは10~50℃程度において行なわれ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~5時間程度である。混合酸無水物法は一般に溶媒中で行なわれる。用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用の溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、p-クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒等又は之等の混合溶媒等が挙げられる。混合酸無水物法において使用されるアルキルハロ炭酸エステルとしては例えばクロロ蟻酸メチル、ブromo蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブromo蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸(3)、アルキルハロ炭酸エステル及びアミン(2)の使用割合は、通常等モルずつとするのがよいが、アミン(2)に対してアルキルハロ炭酸エステル及びカルボン酸(3)はそれぞれ1~1.5倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

【0260】また前記その他の方法(ニ)の内、カルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば上記ショッテンーバウマン反応に用いられる塩基性化合物の他に、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。また用いられる溶媒としては、例えば上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、ピリジン、アセトン、水等を例示できる。アミン(2)とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択でき、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~5倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常-20~180℃程度、好ましくは0~150℃程度にて行なわれ、一般に5分~30時間程度で反応は完結する。

【0261】更に上記反応式-1に示すアミド結合生成反応は、カルボン酸(3)とアミン(2)とを、フェニルホスフィン-2,2'-ジチオジピリジン、ジフェニルホスフィニルクロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリド、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド等のリン化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても実施できる。

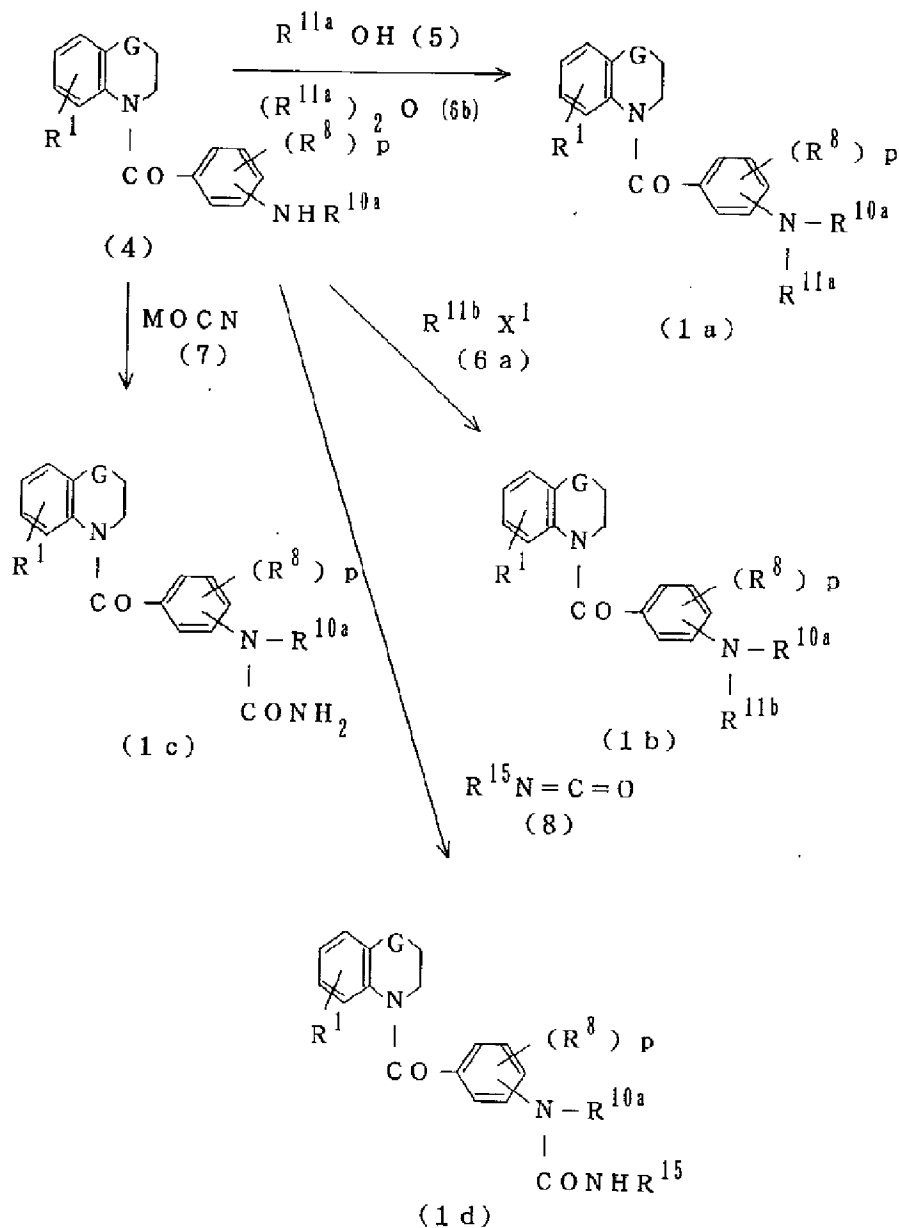
【0262】該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常-20~150℃程度、好ましくは0~100℃程度付近にて行なわれ、一般に5分~30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン

酸(3)の使用量はアミン(2)に対して夫々少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~2倍モル量程度使用するのがよい。

【0263】

【化29】

反応式-2

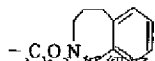


【0264】〔式中G、p、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^8 及びXは前記に同じ。 R^{10a} は、水素原子、低級アルキル基又は置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す。 R^{11a} は、置換基としてハロゲン原子及び水酸基なる群より選ばれた基を有することのある低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル

基を有することのあるアミノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基置換アミノ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルカノイル部分に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、基

【0265】

【化30】



【0266】、フェノキシ低級アルコキシカルボニル基、キノリルカルボニル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリルオキシ置換低級アルカノイル基、ピリジル低級アルコキシカルボニル基、フルオレニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルケニルオキシカルボニル基、テトラヒドロナフチルオキシ置換低級アルカノイル基、ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシカルボニル基、ベンゾフリルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、テトラヒドロイソキノリルカルボニル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基又はフェニル低級アルケニルカルボニル基を示す。R^{11b}は、低級アルキル基、シクロアルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、置換基として低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基、ベンゾイル低級アルキル基又は低級アルキルスルホニル基を示す。X¹はハロゲン原子を示す。Mはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。R¹⁵は低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基又はフェニル低級アルキル基を示す。]

化合物(4)と化合物(5)の反応は前記反応式-1の化合物(2)と化合物(3)の反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0267】化合物(4)と化合物(6a)の反応は、一般に適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行なわれる。用いられる不活性溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、酢酸、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリ

ウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート、ピリジン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン (DABCO)等の有機塩基等を挙げることができる。化合物(4)と化合物(6a)との使用割合としては、特に限定がなく広い範囲で適宜選択すればよいが、前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~10倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常0~200℃程度、好ましくは0~170℃程度にて行なわれ、一般に30分~75時間程度で反応は終了する。該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物、銅粉等を添加してもよい。

【0268】化合物(4)と化合物(6b)の反応は、後記反応式-9における化合物(1t)と化合物(18)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0269】化合物(4)と化合物(7)との反応は、酸の存在下、適当な溶媒中に行なわれる。ここで使用される酸としては、例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、塩酸、硫酸等の鉱酸等を挙げることができる。使用される溶媒としては、前記反応式-1のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。化合物(7)の使用量は、化合物(4)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル~3倍モル量程度とするのがよい。該反応は、通常0~150℃、好ましくは室温~100℃付近にて行なわれ、通常10分~5時間程度にて反応は終了する。

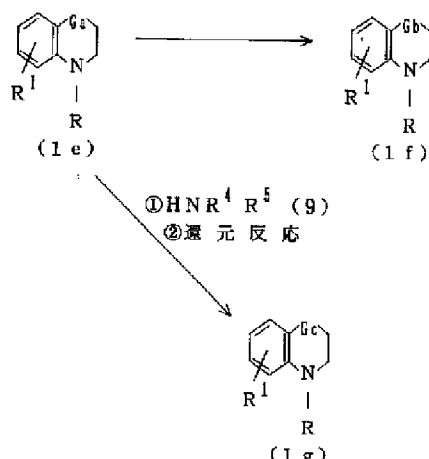
【0270】化合物(4)と化合物(8)との反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に、適当な溶媒中又は無溶媒下で行なわれる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物は、前記反応式-1のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0271】化合物(8)の使用量としては、化合物(4)に対して通常等モル~5倍モル量程度、好ましくは等モル~3倍モル量程度とするのがよい。該反応は通常0~200℃程度、好ましくは室温~150℃程度付近の温度で、通常5分~30時間程度を要して行なわれる。該反応には三弗化ほう素エチルエーテル等の硼素化合物を添加してもよい。

【0272】

【化31】

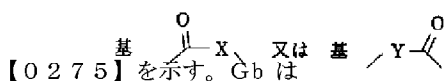
反応式～3



【0273】〔式中R¹及びRは前記に同じ。Gₐは

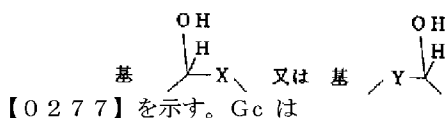
【0274】

【化32】



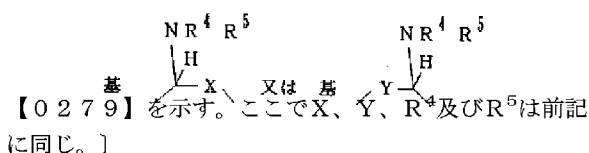
【0276】

【化33】



【0278】

【化34】



化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応は還元反応により行ない得る。この還元反応には、水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、水素化硼素リチウム、水素化硼素ナトリウム、ジボラン等が挙げられ、その使用量は原料化合物に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～1.5倍モルの範囲である。この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等のエーテル類やこれらの混合溶媒等を用い、通常約-60～150℃、好ましくは-30～100℃にて、約10分間～15時間程度で行なわれる。尚、還元剤として水素化アルミニウムリチウムやジボランを用いた場合は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグ

ライム等の無水の溶媒を用いるのがよい。

【0280】化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、脱水剤の非存在下又は存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。脱水剤としては、例えばモレキュラーシーブ等の通常の溶媒の脱水に用いられる乾燥剤、塩酸、硫酸、三弗化ホウ素等の鉱酸、p-トルエンスルホン酸、酢酸等の有機酸等を挙げることができる。該反応は、通常室温～250℃、好ましくは50～200℃程度にて行なわれ、一般に1～48時間程度で反応は終了する。化合物(9)の使用量としては、特に制限されないが、通常化合物(1e)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量使用するのがよい。また脱水剤の使用量としては、乾燥剤の場合には通常大過剰量、酸を用いる場合には触媒量とするのがよい。

【0281】引き続き還元反応には、種々の方法が適用でき、適当な溶媒中触媒の存在下、接触水素添加することにより行ない得る。使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒又は之等の混合溶媒等が挙げられる。また使用される触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。触媒は、原料化合物に対して一般に0.02～1倍量程度用いるのがよい。反応温度は通常-20～100℃付近、好ましくは0～70℃付近、水素圧は通常1～10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5～20時間程度で終了する。

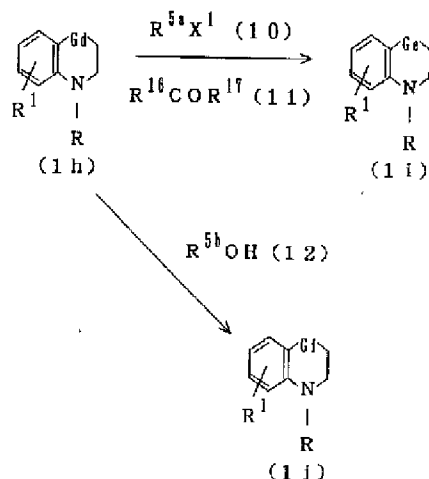
【0282】上記還元反応条件を利用できるが、好ましくは水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム、ジボラン等が挙げられ、その使用量は、通常化合物(1e)に対して少なくとも0.1倍モル、好ましくは0.1倍モル～10倍モルの範囲である。この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル類、ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒等を用い、通常約-60～50℃、好まし

くは -30°C ～室温にて、約10分間～5時間程度で行なわれる。なお、還元剤として水素化アルミニウムリチウムやジボランを用いた場合には、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジグライム等の無水の溶媒を用いるのがよい。

【0283】

【化35】

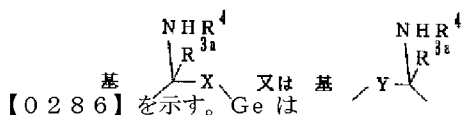
反応式-4



【0284】〔式中 R^1 及び R は前記に同じ。 R^{3a} は水素原子又は水酸基置換低級アルキル基を示す。 R^{5a} は置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を示す。 R^{16} 及び R^{17} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。 R^{5b} は、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基を示す。 Gd は

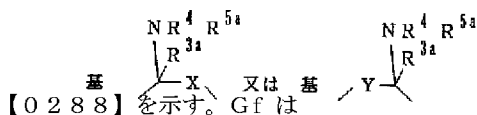
【0285】

【化36】



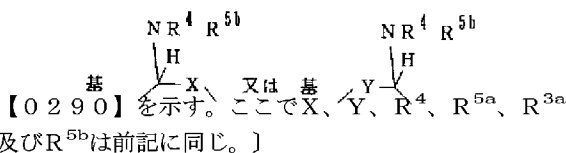
【0287】

【化37】



【0289】

【化38】



【0290】を指示。ここで X 、 Y 、 R^4 、 R^{5a} 、 R^{3a} 及び R^{5b} は前記に同じ。]

化合物(1h)と化合物(10)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6)の反応と同

様の条件下に行なわれることができる。

【0291】化合物(1h)と化合物(11)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、アセトニトリル、ギ酸、酢酸、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライム、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、又は之等の混合溶媒を例示できる。還元剤としては例えばギ酸、ギ酸アンモニウム、ギ酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触還元剤等を例示できる。

【0292】還元剤としてギ酸を使用する場合、反応温度は通常室温～ 200°C 程度、好ましくは $50\sim150^{\circ}\text{C}$ 程度付近が適当であり、反応は1～10時間程度にて終了する。ギ酸の使用量は化合物(1h)に対して大過剰量使用するのがよい。

【0293】また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常 $-30\sim100^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $0\sim70^{\circ}\text{C}$ 程度が適当であり、30分～12時間程度で反応は完結する。還元剤の使用量は、化合物(1h)に対して通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは1～6倍モル量程度とするのがよい。特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。

【0294】更に接触還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又はギ酸、ギ酸アンモニウム、シクロヘキセン、抱水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常 $-30\sim100^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $0\sim60^{\circ}\text{C}$ 程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触還元剤の使用量としては化合物(1h)に対して通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。水素供与剤の使用量としては化合物(1h)に対して通常大過剰量とするのがよい。

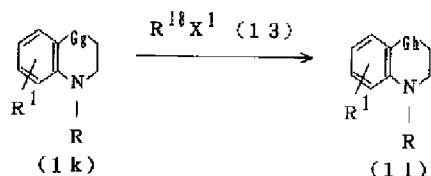
【0295】また化合物(11)の使用量としては化合物(1h)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

【0296】化合物(1h)と化合物(12)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の反応条件下に行ない得る。

【0297】

【化39】

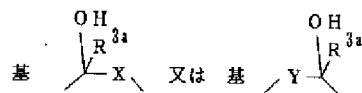
反応式-5



【0298】〔式中R¹、R^{3a}、R、X及びX¹は、前記に同じ。Ggは

【0299】

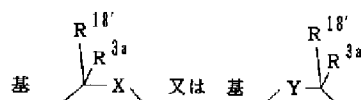
【化40】



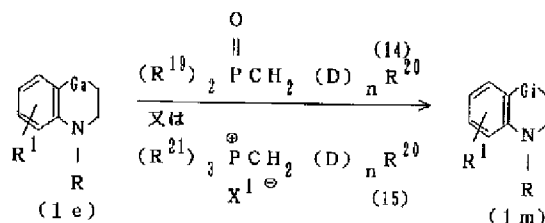
【0300】を示す。Ghは

【0301】

【化41】



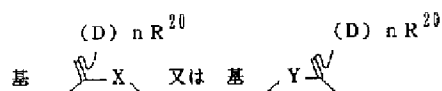
反応式-6



【0304】〔式中R¹、R、X¹及びGaは前記に同じ。Giは

【0305】

【化43】



【0306】を示す。X及びYは前記に同じ。R¹⁹は低級アルコキシ基を示す。R²⁰は水素原子、低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ基又はフェニル基を示す。Dは低級アルキレン基を示す。nは0又は1を示す。R²¹はフェニル基を示す。]

化合物(1e)と化合物(14)又は(15)との反応は塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、金属ナトリウム、金属カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウムトートキシド等の金属アルコラート類、メチルリチウム、n-ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリアルリチウム又

【0302】を示す。ここでX、Y及びR^{3a}は前記に同じ。R¹⁸は、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基、カルボキシ基置換低級アルコキシ基又は基-O-ACONR⁶R⁷(A、R⁶及びR⁷は前記に同じ。)を示す。R¹⁸は、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルキル基、カルボキシ基置換低級アルキル基又は基-ACONR⁶R⁷(A、R⁶及びR⁷は前記に同じ。)を示す。]

化合物(1k)と化合物(13)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0303】

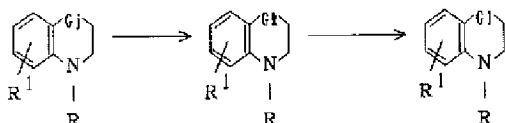
【化42】

はリチウムアミド類、ピリジン、ピペリジン、キノリン、トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン等の有機塩基等を例示できる。溶媒としては、反応に影響を与えないものであればいずれも使用できるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、n-ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ピリジン、N、N-ジメチルアニリン等のアミン類、N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類等が挙げられる。反応温度は、通常-80~150℃、好ましくは-80~120℃付近とするのがよく、一般に0.5~15時間程度で反応は終了する。

【0307】

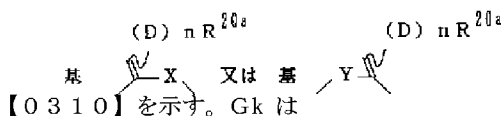
【化44】

反応式-7



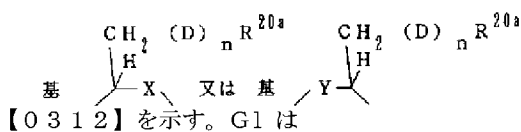
【0308】〔式中 R^1 及び R は前記に同じ。 G^1 は
【0309】

【化45】



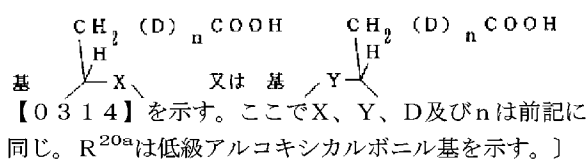
【0311】

【化46】



【0313】

【化47】



【0314】を示す。ここで X 、 Y 、 D 及び n は前記に同じ。 R^{20a} は低級アルコキシカルボニル基を示す。〕
化合物(1n)を化合物(1o)に導く反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1g)に導く場合の還元反応条件と同様の条件下に行なわれる。該還元反応で水素還元剤を用いる還元法を利用するときには、該反応系内に塩化ニッケル等の金属ハロゲン化物を加えると反応は有利に進行する。

【0315】また金属マグネシウム-メタノールを用いて化合物(1n)を還元することによっても、化合物(1o)に導くことができる。この反応は、通常 $0\sim 50^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは 0°C ～室温付近にて行なわれ、一般に $1\sim 10$ 時間程度で反応は完結する。金属マグネシウムは、化合物(1n)に対して通常等モル～ 10 倍モル、好ましくは等モル～ 7 倍モル量使用するのがよい。 X がメチレン基を示す化合物(1n)の場合には、上記反応条件下で X がメチレン基である化合物(1o)に加えて、 X が基 $=\text{CH}-$ である化合物も生成するが、これらの化合物は容易に分離され得る。

【0316】化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下を実施することができる。用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチル

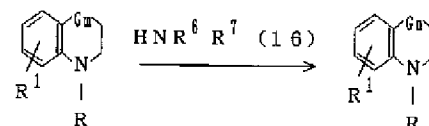
ケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸類、之等の混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。該反応は、通常室温～ 200°C 程度、好ましくは室温～ 150°C 程度にて好適に進行し、一般に 10 分～ 25 時間程度で終了する。

【0317】また化合物(1p)は、化合物(1o)を、適当な溶媒中、ジメチルスルフィド-塩化アルミニウム等のジアルキルスルフィド-ルイス酸の存在下に処理することによっても製造される。溶媒としては、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応で用いられる溶媒をいずれも使用できる。この処理は、通常 $0\sim 70^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $0\sim 50^{\circ}\text{C}$ 付近で、 $1\sim 10$ 時間行なえばよい。

【0318】

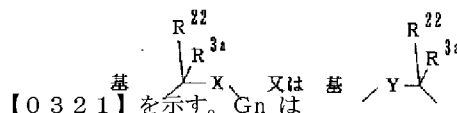
【化48】

反応式-8



【0319】〔式中 R^1 及び R は前記に同じ。 G^1 は
【0320】

【化49】



【0322】

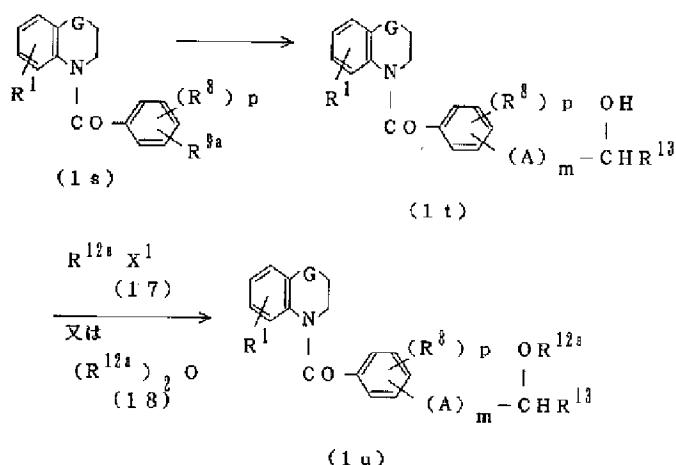
【化50】

【0323】を示す。 R^{22} はカルボキシル置換低級アルキル基を示す。 R^{3a} 、 R^6 、 R^7 、 A 、 X 及び Y は前記に同じ。〕

化合物(1q)と化合物(16)との反応は前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0324】

【化51】



【0325】〔式中G、p、R¹、R⁸、X¹、A、m及びR¹³は前記に同じ。R^{9a}は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるベンゾイル低級アルキル基を示す。R^{12a}は低級アルカノイル基を示す。〕

化合物(1s)を化合物(1t)に導く反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0326】化合物(1t)と化合物(17)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なうことができる。

【0327】化合物(1t)と化合物(18)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下もしくは非存在下、好ましくは存在下に行なわれる。ここで適当な溶媒としては例えば前述した芳香族炭化水素

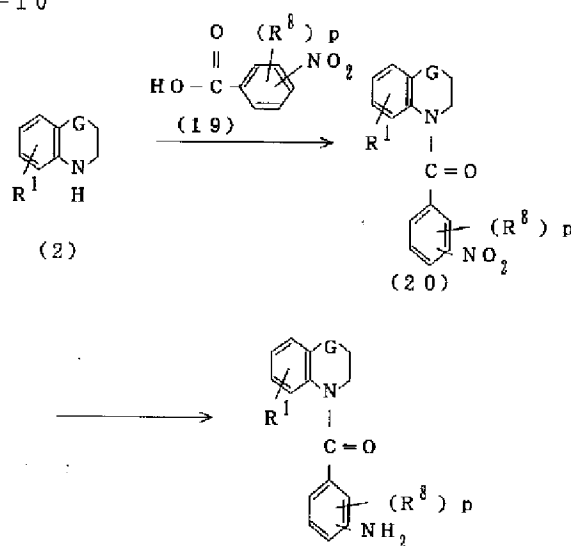
類、メタノール、エタノール、プロパノール等の低級アルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の他、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素類、アセトン、ピリジン等を使用できる。塩基性化合物としては例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等を例示できる。上記反応はまた酢酸等の溶媒中、硫酸等の鉱酸の存在下にも実施することもできる。

【0328】化合物(18)の使用割合は出発原料に対して等モル量〜大過剰量とすればよく、反応は通常0〜200℃程度、好ましくは0〜150℃程度下に、0.5〜20時間程度で完結する。

【0329】出発原料としての化合物(2a)は、例えば下記反応式により製造されることができる。

【0330】
【化52】

反応式-10



【0331】〔式中G、p、R¹及びR⁸は前記に同じ。〕

化合物(2)と化合物(19)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0332】化合物(20)を化合物(4)に導く反応は、例えば(1)適当な溶媒中接触還元触媒を用いて還元するか又は(2)適当な不活性溶媒中、金属もしくは金属塩と酸又は金属もしくは金属塩とアルカリ金属水酸化物、硫化物、アンモニウム塩等との混合物等を還元剤として用いて還元することにより行なわれる。

【0333】(1)の還元触媒を用いる場合、使用される溶媒としては例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N、N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等が挙げられ、使用される接触還元触媒としては例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。触媒は出発原料に対して一般に0.02～1倍量程度用い

るの(4)がよい。反応温度は通常-20～150℃付近、好ましくは0～100℃付近、水素圧は通常1～10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5～10時間程度で終了する。また該反応には塩酸等の酸を添加してもよい。

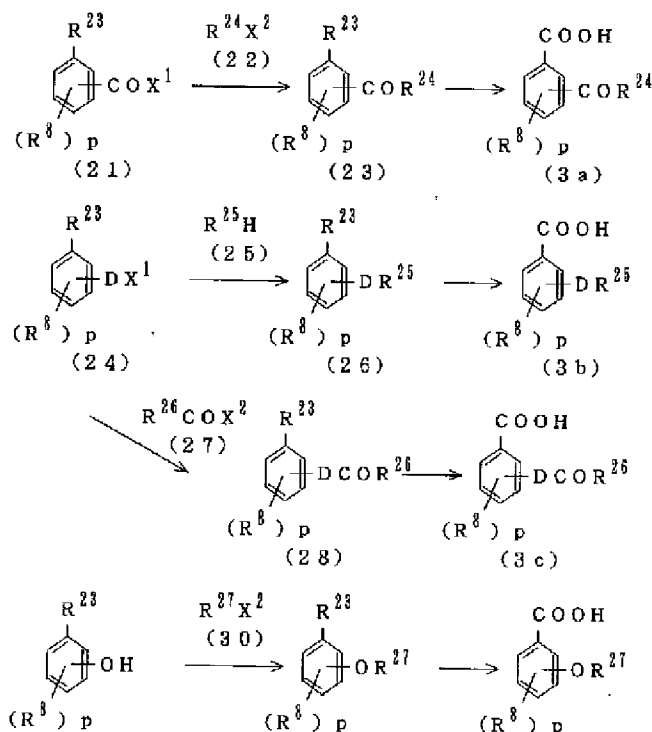
【0334】また(2)の方法を用いる場合、鉄、亜鉛、錫もしくは塩化第一錫と塩酸、硫酸等の鉱酸、又は鉄、硫酸第一鉄、亜鉛もしくは錫と水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、硫化アンモニウム等の硫化物、アンモニア水、塩化アンモニウム等のアンモニウム塩との混合物が還元剤として用いられる。使用される不活性溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、ジオキサン等を例示できる。上記還元反応の条件としては、用いられる還元剤によって適宜選択すればよく、例えば塩化第一錫と塩酸とを還元剤として用いる場合、有利には0～80℃付近、0.5～10時間程度反応を行なうのがよい。還元剤は、原料化合物に対して少なくとも等モル量、通常は等モル～5倍モル量用いられる。

【0335】出発原料の(3)は例えば下記反応式により製造されることができる。

【0336】

【化53】

反応式-11



【0337】〔式中p、R⁸、D及びX¹は前記に同じ。R²⁴はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル低級アルキル基を示す。X²はハロゲン原子を示す。R²³は低級アルコキシカルボニル基を示す。R²⁵は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ基を示す。R²⁶は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基を示す。R²⁷は、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基、又はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル低級アルキル基を示す。〕

化合物(21)と化合物(22)との反応及び化合物(24)と化合物(27)との反応は、適当な溶媒中、亜鉛及び触媒の共存下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、1, 2-ジメトキシエタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。触媒としては、例えばテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム[Pd(PPh₃)₄]、酢酸パラジウム[Pd(OCOCH₃)₂]、塩化パラジウム[PdCl₂]、ビストリフェニルホスフィンニッケルジクロリド[Ni(PPh₃)₂Cl₂]等の様々なパラジウム化合物やニッケル化合物を例示できる。該反応は、通常

50℃～70℃、好ましくは0～50℃付近にて行なわれ、一般に1～80時間程度にて終了する。

【0338】化合物(24)又は化合物(27)の使用量は、化合物(21)又は化合物(22)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量程度とするのがよい。触媒の使用量としては、通常0.01倍～等モル程度、好ましくは0.03～0.3倍モル量程度とするのがよい。

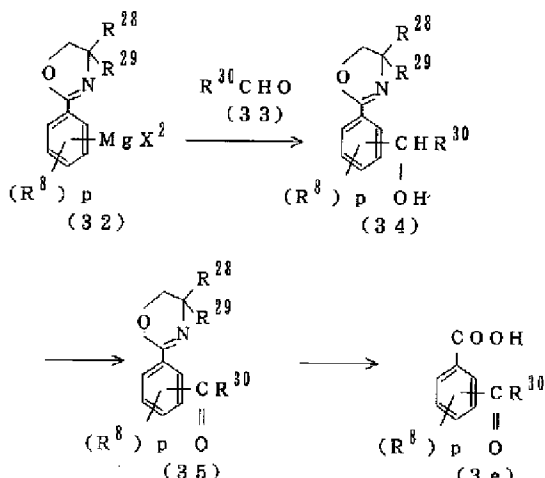
【0339】化合物(24)と化合物(25)との反応及び化合物(29)と化合物(30)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0340】化合物(23)、(26)、(28)又は(31)をそれぞれ化合物(3a)、(3b)、(3c)又は(3d)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0341】

【化54】

反応式-12



【0342】〔式中 R^{28} 及び R^{29} は、それぞれ低級アルキル基を示す。 R^{30} はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基を示す。 p 、 R^8 及び X^2 は前記に同じ。〕

化合物(32)と化合物(33)との反応は、適当な溶媒中で行なわれる。ここで使用される溶媒としては、グリニヤール反応で使用される溶媒ならいずれも使用可能であるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の飽和炭化水素類等を好ましく例示できる。化合物(33)の使用量としては、化合物(32)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。上記反応は通常 $-70\sim 50^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは -30°C ～室温付近にて行なわれ、一般に1～50時間程度で終了する。

【0343】化合物(34)を化合物(35)に導く反応は、適当な溶媒中、酸化剤の存在下に行なわれる。ここで使用される酸化剤としては、ピリジニウムクロクロメイト、ピリジニウムジクロクロメイト等のクロム酸ピリジニウム塩、ジメチルスルホキシド-オキサリクロリド、重クロム酸、重クロム酸ナトリウム、重クロム酸カリウム等の重クロム酸塩、過マンガン酸、過マンガン酸カリウム、過マンガン酸ナトリウム等の過マンガン酸塩、二酸化マンガン、2, 3-ジクロロ-5, 6-ジシアノ-1, 4-ベンゾキノン(DDQ)等を例示できる。また使用される溶媒としては、例えば、水、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、メタノール、エタノール等のアルコール類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒を例示できる。酸化剤は、通常出発原料に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～2.5倍モル

量使用するのがよい。反応は、通常 $0\sim 100^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $0\sim 70^{\circ}\text{C}$ 程度にて行なわれ、一般に1～7時間程度にて終了する。

【0344】化合物(35)を化合物(3e)に導く反応は、適当な溶媒中、アルキル化剤の存在下に化合物(35)をアルキル化した後、得られる化合物を加水分解するか、又は化合物(35)を直接加水分解することにより行なわれる。

【0345】化合物(35)をアルキル化するに当り、使用されるアルキル化剤としては、沃化メチル等のハロゲン化アルキル等を例示できる。アルキル化は、通常室温～ 200°C 、好ましくは室温～ 150°C にて行なわれ、一般に1～30時間程度にて終了する。使用される溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド、アセトン、アセトニトリル、ニトロメタン等の極性溶媒を例示できる。アルキル化剤は、化合物(35)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～8倍モル量使用するのがよい。

【0346】引続き行なわれる加水分解反応には、通常の加水分解の反応条件をいずれも適用でき、具体的には例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム等の塩基性化合物又は塩酸、硫酸等の鉱酸、酢酸等の有機酸等の存在下、水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸等の溶媒又はそれらの混合溶媒中にて行なわれる。該反応は、通常室温～ 200°C 、好ましくは室温～ 150°C 付近にて進行し、一般に0.5～20時間程度にて終了する。

【0347】化合物(35)を直接加水分解する反応も、上記加水分解条件と同様の条件下に行ない得る。この場合の反応時間は1～30時間程度とするのがよい。

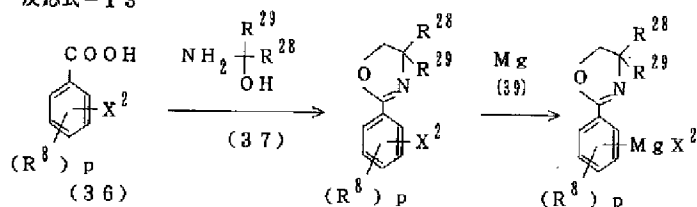
【0348】また化合物(35)を硫酸、塩酸、硝酸等の鉱酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等の存在下、上記加水分解と同様の溶媒、反応温度、反応時間にて加水分解することによっても化合物(3e)を得ることができる。

【0349】出発原料の化合物(32)は例えば下記反応式-13に示す方法で製造されることができる。

【0350】

【化55】

反応式-13



【0351】〔式中 p 、 R^8 、 R^{28} 、 R^{29} 及び X^2 は前記に同じ。〕

化合物(36)と化合物(37)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応のうちカルボン酸ハライドを用いる方法と同様の条件下に行なわれることができる。化合物(37)の使用量としては化合物(36)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。

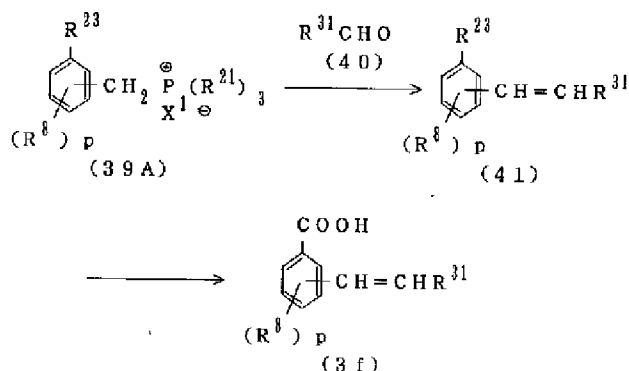
【0352】化合物(38)を化合物(39)との反応は、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジ

メキサン、モノグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、 n -ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類等溶媒中、通常 $0\sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは $0\sim 100^\circ\text{C}$ 付近にて、 $0.5\sim 5$ 時間程度反応させることにより行なうことができる。化合物(39)の使用量は化合物(38)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル～1.5倍モル量程度とするのがよい。

【0353】

【化56】

反応式-14



【0354】〔式中 p 、 R^8 、 R^{23} 、 R^{21} 及び X^1 は前記に同じ。 R^{31} はフェニル環上にハロゲン原子を有することのあるフェニル基を示す。〕

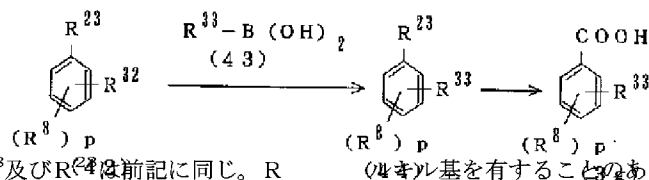
化合物(39A)と化合物(40)との反応は、前記反応式-6における化合物(1e)と化合物(14)又は(15)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0355】化合物(41)を化合物(3f)に導く反応は、前記反応式-6における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0356】

【化57】

反応式-15



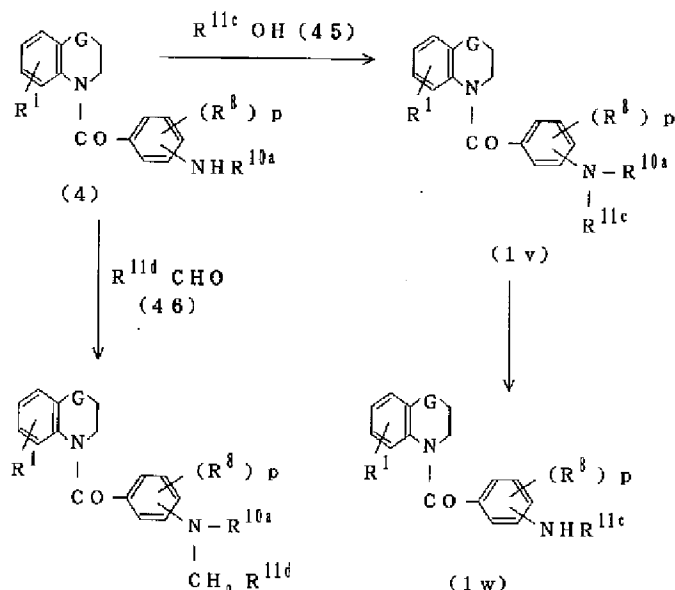
【0357】〔式中 p 、 R^8 及び R^{32} は前記に同じ。 R^{32} はハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニルオキシ基又はハロゲン原子を示す。 R^{33} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、フェニル基及び置換基として低級ア

ルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基を示す。〕

化合物(42)と化合物(43)との反応は、適当な溶媒中、リチウムクロリド等のリチウム化合物の存在下又は不存在下、塩基性化合物及び触媒の存在下で行なわれる。ここで使用される溶媒としては、前記反応式-13における化合物(38)と化合物(39)との反応で例

示された溶媒をいずれも使用することができる。塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)の反応のうちカルボン酸ハライドを用いる方法で例示された塩基性化合物をいずれも使用することができる。触媒としては、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、塩化パラジウム等のパラジウム化合物を挙げることができる。該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行なわれ、一般に1～10時間程度にて終了する。塩基性化合物

反応式-16



【0360】〔式中G、p、R¹、R⁸及びR^{10a}は前記に同じ。R^{11c}は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することがあり、且つ低級アルキル基部分に水酸基を有することのあるフェニル低級アルキル基、ベンゾイル低級アルキル基、又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基を示す。R^{11d}は、前記R^{11c}に加えて、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基を示す。〕
化合物(4)と化合物(45)との反応は、例えばジエチルアゾジカルボキシレート、ジブチルアゾジカルボキシレート等のジアルキルアゾジカルボキシレート類、1, 1'-アゾジカルボニルジ(ピペリジン)等のジアルキルアゾジカルボキシアミド類及びトリアルキルホスフィン、トリアルキルホスフィン等のリン酸化合物の存在下に反応させることにより製造される。使用される溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。ジアルキルアゾジカルボキシレート類、リン酸化

物及びリチウム化合物は、化合物(42)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量使用するのがよい。また触媒は、触媒量使用するのがよい。

【0358】化合物(44)を化合物(3g)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0359】

【化58】

化合物及び化合物(45)は、化合物(4)に対してそれぞれ少なくとも等モル程度、好ましくは1～3倍モル程度用いるのがよい。該反応は、通常-20～100℃、好ましくは-20～50℃にて進行し、一般に1～30時間で反応は終了する。

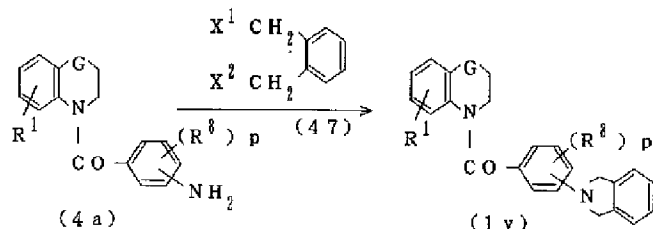
【0361】R^{10a}が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基を示す化合物(1v)の場合、該化合物を加水分解することにより、対応する化合物(1w)に導くことができる。この反応は、後記一般式(1)においてR⁹がフェニル環上に低級アルカノイルオキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物の加水分解反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0362】化合物(4)と化合物(46)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を(1g)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。化合物(46)の使用量は、化合物(4)に対して少なくとも等モル、好ましくは1～3倍モル量とするのがよい。

【0363】

【化59】

反応式-17



【0364】〔式中G、p、R¹、R⁸、X¹及びX²は前記に同じ。〕

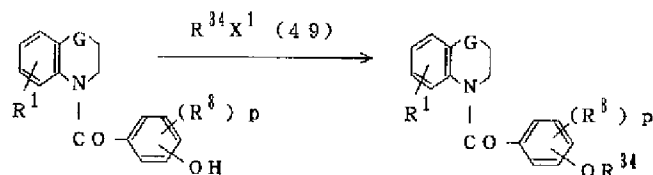
化合物(4a)と化合物(47)の反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同

様の条件下に行なわれることができる。

【0365】

【化60】

反応式-18



【0366】〔式中G、p、R¹、R⁸及びX¹は前記に同じ。R³⁴は、低級アルキル基、低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基並びに置換基として低級アルキル基及び置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノカルボニル基なる群より選ばれた基を有

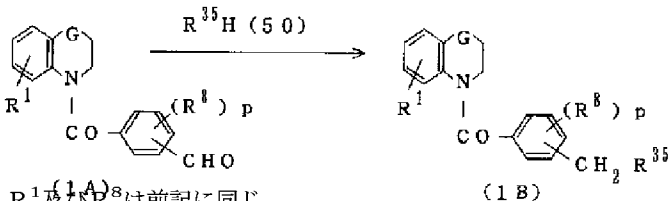
することのあるフェニル低級アルキル基、又はピロリジニル置換低級アルキル基を示す。〕

化合物(48)と化合物(49)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0367】

【化61】

反応式-19



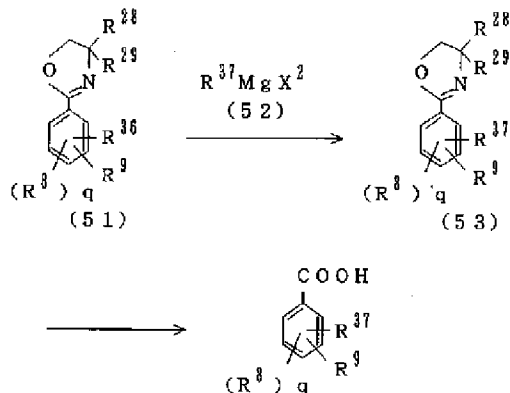
【0368】〔式中G、p、R¹及びR⁸は前記に同じ。R³⁵はフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニノ基を示す。〕

化合物(1A)と化合物(50)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。化合物(50)の使用量は、化合物(1A)に対して、少なくとも等モル量、好ましくは等モル~5倍モル量とするのがよい。

【0369】

【化62】

反応式-20



【0370】〔式中R³⁶は低級アルキル基又はハロゲン原子を示す。R³⁷は低級アルキル基を示す。R⁸、R²⁸、R²⁹、R⁹及びX²は前記に同じ。qは0又は1を示

す。]

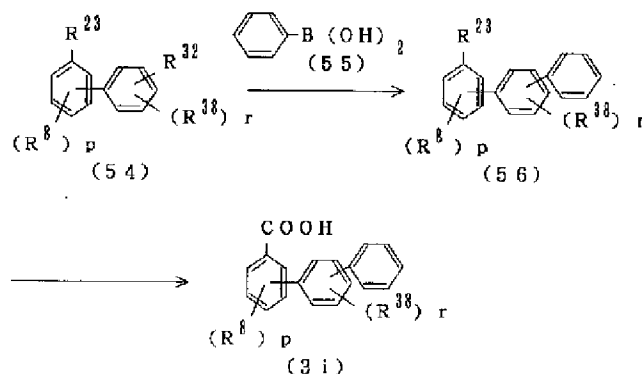
化合物(51)と化合物(52)との反応は、前記反応式-12における化合物(32)と化合物(33)の反応と同様の条件下にて行なわれる。化合物(52)の使

用量は化合物(51)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル〜2倍モル量とするのがよい。

【0371】

【化63】

反応式-21



【0372】〔式中 R^8 、 p 、 R^{32} 及び R^{23} は前記に同じ。 R^{38} は、低級アルキル基、低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基、低級アルカノイルオキシ基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、ニトロ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基を示す。 r は0、1又は2を示す。〕

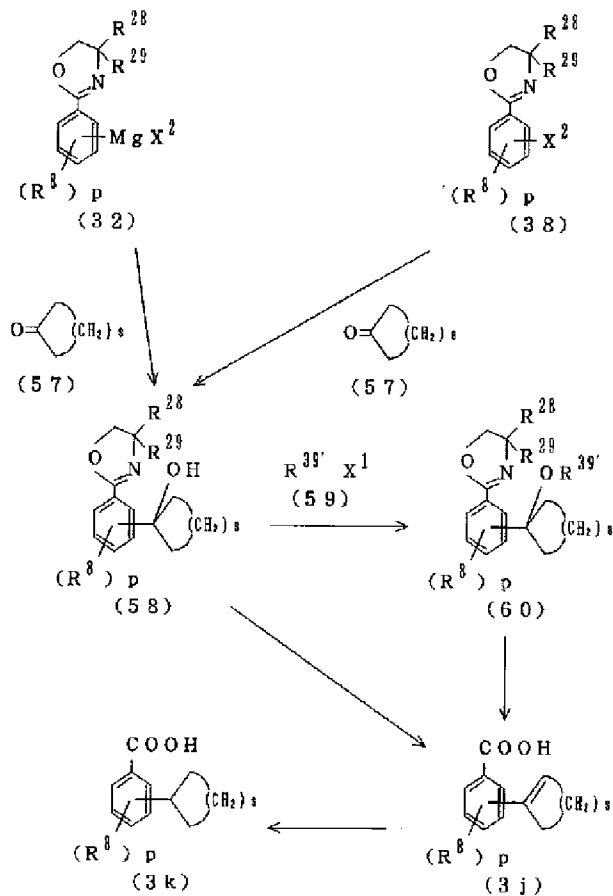
化合物(54)と化合物(55)との反応は、前記反応式-15における化合物(42)と化合物(43)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0373】化合物(56)を化合物(3i)に導く反応も、前記反応式-15の化合物(44)を化合物(3g)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0374】

【化64】

反応式-22



【0375】〔式中 R^{28} 、 R^{29} 、 R^8 、 p 、 X^1 及び X^2 は前記に同じ。 s は0～5の整数を示す。 $R^{39'}$ は低級アルキル基を示す。〕

化合物(32)と化合物(57)との反応は、前記反応式-12における化合物(32)と化合物(33)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0376】化合物(58)と化合物(59)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0377】化合物(38)と化合物(57)との反応は、前記反応式-6における化合物(1e)と化合物(14)又は化合物(15)との反応と同様の条件下に行なわれる。化合物(57)の使用量は、化合物(3

8)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～

1.5倍モル量とするのがよい。

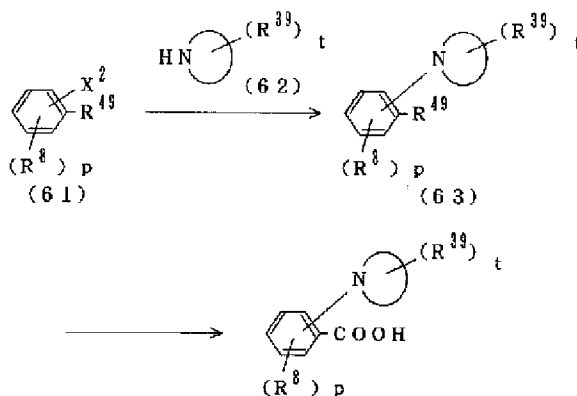
【0378】化合物(58)又は化合物(60)を化合物(3j)に導く反応は、反応時間が一般に1～50時間程度で終了する他は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0379】化合物(3j)を化合物(3k)に導く反応は、前記反応式-3における化合物(1e)を化合物(1g)に導く反応中の接触水素添加する方法と同様の条件下に行なわれる。

【0380】

【化65】

反応式-23



【0381】〔式中 R^8 、 p 及び X^2 は前記に同じ。 R^{39} は低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハゲン原子、フェニル低級アルキル基又はオキシ基を示す。 t は0～3の整数を示す。 R^{49} はシアノ基、低級アルコキシカルボニル基又はカルボキシル基を示す。基

【0382】

【化66】



【0383】は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和又は不飽和の5員～11員環の単環又

は3-4員環の複素環基を示す。〕

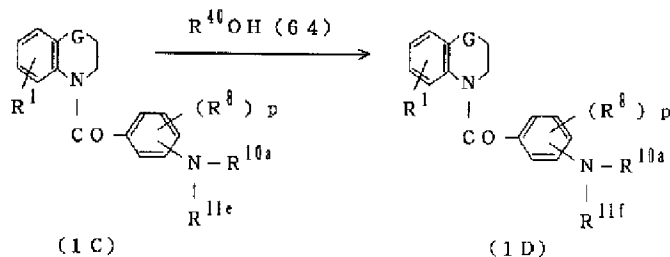
化合物(61)と化合物(62)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0384】 R^{49} がシアノ基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物(63)の場合、化合物(63)を化合物(3k)に導く反応は、前記反応式-7の化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0385】

【化67】

反応式-24

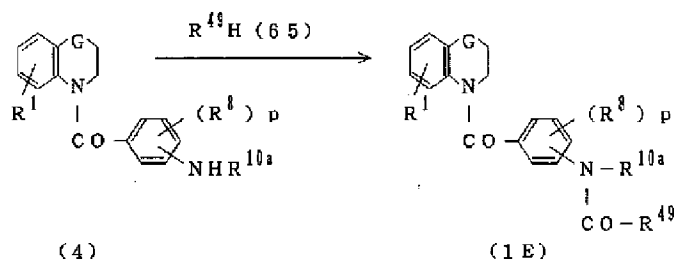


【0386】〔式中 G 、 R^1 、 R^8 、 p 及び R^{10a} は前記に同じ。 R^{11e} は、置換基としてハロゲン原子を有する低級アルカノイル基を示す。 R^{40} は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキ

シ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、低

級アルキル基、低級アルカノイル基、キノリル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるテトラヒドロキノリル基又はテトラヒドロナフチル基を示す。R^{11f}は、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、低級アルカノイル基置換アミノ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基、低級アルコキシ置換低級アルカノイル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリルオキシ置換低級アルカノイル基、キノリン環上に置換基として低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある

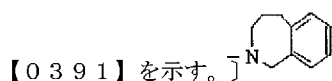
反応式-25



【0389】〔式中R¹、G、R⁸、p及びR^{10a}は前記に同じ。R⁴⁹はテトラヒドロイソキノリル基又は基

【0390】

【化69】



化合物(4)を化合物(1E)に導く反応は、(1)適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に化合物(4)とカルボニル化剤とを反応させた後、次いで(2)適当な溶媒中、上記で得られる反応生成物を塩基性化合物の存在下化合物(65)と反応させることにより実施される。

【0392】(1)の反応において、使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-1のカルボン酸ハライドにアミン(2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。使用されるカルボニル化剤としては、カルボニルジイミダゾール、ホスゲン、ダイホスゲン、尿素、トリホスゲン等を例示できる。カルボニル化剤の使用量は、化合物(4)に対して、通常0.05~等モル、好ましくは0.1~等モル量とするのがよい。該反応は、通常0~200℃、好ましくは0~180℃付近にて、1~10時間程度にて終了する。

【0393】(2)の反応において、使用される溶媒及び塩基性化合物は、前記(1)の反応で用いた溶媒及び塩基

性化合物をいずれも使用することができる。また(1)と(2)の反応は、分離することなくワンポットで行うこともできる。化合物(65)の使用量は、化合物(4)に対して通常等モル~5倍モル、好ましくは等モル~3モル量とするのがよい。該反応は通常室温~150℃、好ましくは、室温~120℃付近にて、0.5~5時間程度にて終了する。

化合物(1C)と化合物(63)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0387】R^{11f}が低級アルカノイルオキシ置換低級アルカノイル基である化合物(1D)を前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の条件下に反応させて、対応するR^{11f}が置換基として水酸基を有する低級アルカノイル基である化合物(1D)に導くことができる。

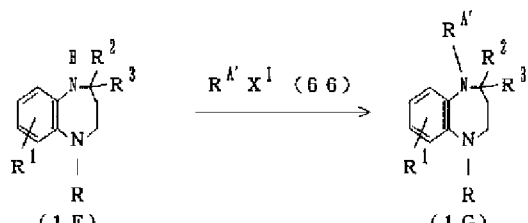
【0388】

【化68】

【0394】

【化70】

反応式-26



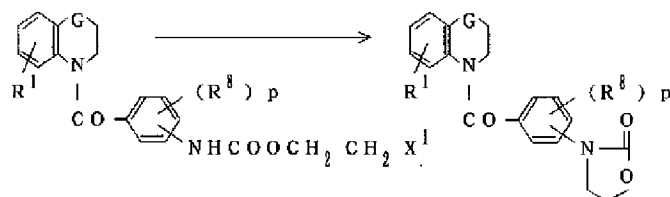
【0395】〔式中R¹、R²、R³、R及びX¹は前記に同じ。R^{A'}は水素原子以外のR^Aを示す。〕

化合物(1F)と化合物(66)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0396】

【化71】

反応式-27



(1H)

【0397】〔式中 R^1 、 G 、 R^8 、 p 及び X^1 は前記に同じ。〕

化合物(1H)を化合物(1I)に導く反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反

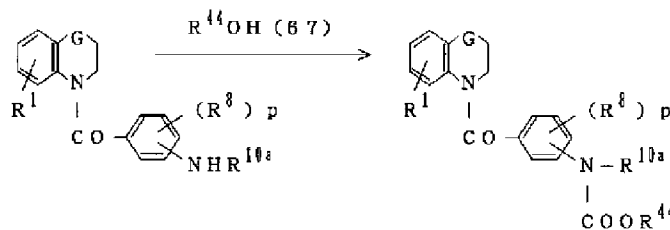
(1I)

応と同様の条件下に行なわれる。

【0398】

【化72】

反応式-28



(4)

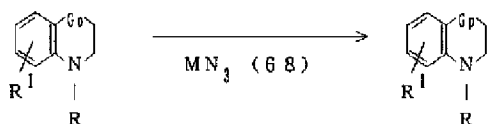
【0399】〔式中 R^1 、 G 、 R^8 、 p 及び R^{10a} は前記に同じ。 R^{44} は、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェノキシ低級アルキル基、フェニル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基、フルオレニル低級アルキル基、低級アルケニル基又はピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基、低級アルコシカルボニル基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基を示す。〕

化合物(4)と化合物(67)との反応は、前記反応式-25における化合物(4)を化合物(1E)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0400】

【化73】

反応式-29



【0401】〔式中 R^1 及び R は前記に同じ。 G 及び p は

【0402】

【化74】

【0403】 $R^{34}R^{45}$ を基、又は基 $R^{34}R^{45}$ を示す。又は基 $R^{34}R^{45}$ を示す。

【0404】 G 及び p は

【0405】

【0406】 $R^{34}R^{45}$ を基、又は基 $R^{34}R^{45}$ を示す。ここで R^{34} 、 X 及び Y は前記に同じ。 R^{45} はシアノ置換低級アルキル基を示す。 R^{46} はテトラゾリル基置換低級アルキル基を示す。 M はナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。〕

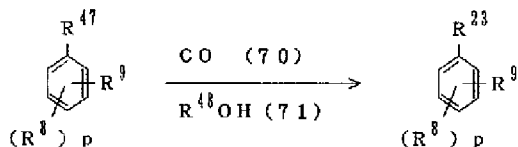
化合物(1K)を化合物(1L)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に化合物(1K)を化合物(68)と反応させることにより行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、 N -メチルピロリドン、無水酢酸、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチリン酸トリアミド等の極性溶媒等を例示できる。ここで使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、金属ナトリウム、金属カリウム、ナトリウムアミド等の無機塩基、 N 、 N -ジメチルアニリン、ピペリジン、ピリジン、トリエチルアミン、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の有機塩基等を例示できる。化合物(6

8)の使用量は、化合物(1K)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～5倍モル量とするのがよい。該反応は通常室温～200℃、好ましくは50～150℃付近にて、1～40時間程度にて終了する。

【0407】

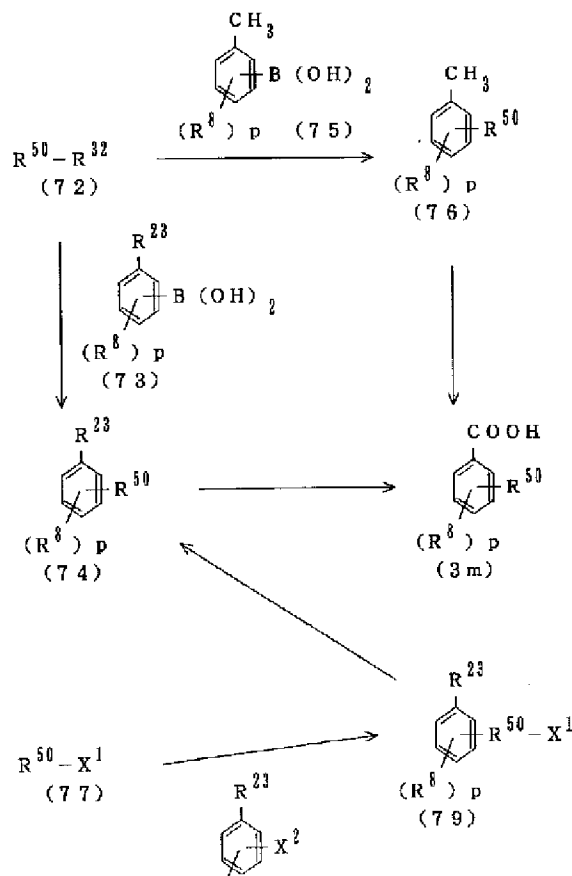
【化76】

反応式-30



【0408】〔式中R⁸、p、R⁹及びR²³は前記に同じ。R⁴⁷はハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニルオキシ基を示す。R⁴⁸は低級アルキル基を示す。〕

反応式-31



【0410】〔式中R⁵⁰は窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する飽和もしくは不飽和の5～11員環の単環又は二項環の複素環基（該複素環基には置換基として低級アルキル基、フェニル基、低級アルカノイル基、ハロゲン原子、フェニル低級アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい。）を示す。R³²、R²³、R⁸、p、X¹及びX²は前

化合物(69)、一酸化炭素(70)及び化合物(71)の反応は、適当な溶媒中触媒及び塩基性化合物の存在下反応させることにより行なわれる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)の反応の内、カルボン酸ハライドを用いる方法で例示された溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。触媒としては、酢酸パラジウム、1,3-ビス(ジフェニルフォスフィノ)プロパン(dppp)等を例示できる。該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて、1～10時間程度に終了する。化合物(70)、化合物(71)及び触媒は、化合物(69)に対して通常それぞれ大過剰量使用するのがよい。

【0409】

【化77】

化合物(72)と化合物(73)との反応は、前記反応式-21における化合物(54)と化合物(55)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0411】化合物(74)を化合物(3m)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1o)を化合物(1p)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0412】化合物(72)と化合物(75)との反応は、前記反応式-21における化合物(54)と化合物(55)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0413】化合物(76)を化合物(3m)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は不存在下及び酸化剤の存在下に行われる。ここで使用される溶媒及び酸化剤は、前記反応式-12における化合物(34)を化合物(35)に導く反応と同様の溶媒、酸化剤を例示できる。酸化剤の使用量は、化合物(76)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～4倍モル量とするのがよい。また使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等を例示できる。該反応は、通常0～150℃程度、好ましくは0～120℃程度にて行われ、一般に1～7時間程度で終了する。

【0414】化合物(77)から化合物(79)を導く反応は、化合物(77)を適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下、通常-80～50℃、好ましくは-80℃～室温付近にて一般に0.5～5時間程度処理した後、同様の溶媒中、亜鉛、塩化亜鉛等の亜鉛化合物、触媒及び塩基性化合物の存在下、化合物(78)を反応させることにより行われる。化合物(77)の処理時に使用される塩基性化合物としては、例えばメチルリチウム、n-ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリールリチウム又はリチウムアミド類等が挙げられる。また化合物(78)との反応時に使用される塩基性化合物としては、ジイソプロピルエチルアミンに加えて、前記反応式-1における化合物(3)のカルボン酸ハライドとアミン(2)との反応で用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。化合物(77)の処理時及び化合物(78)との反応時の塩基性化合物の使用量は、化合物(77)

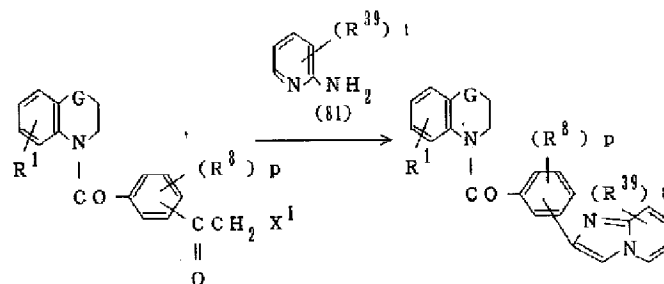
に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。また亜鉛化合物の使用量は、化合物(77)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。使用される溶媒及び触媒、並びに触媒、化合物(77)及び化合物(78)の使用量は、前記反応式-11における化合物(21)と化合物(22)との反応と同様の反応条件下に行われる。該反応は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃付近にて行われ、一般に1～10時間程度で終了する。

【0415】化合物(79)を化合物(74)に導く反応は、適当な溶媒中、接触還元触媒を用いて還元することにより行われる。使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N, N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。また使用される接触還元触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。斯かる触媒は、出発原料に対して一般に0.02～1倍量程度用いるのがよい。また該反応の反応系内には酢酸ナトリウム等を添加してもよい。反応温度は通常-20～150℃付近、好ましくは0～100℃付近、水素圧は通常1～10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5～10時間程度で終了する。

【0416】

【化78】

反応式-32



【0417】〔式中、 R^1 、 G 、 $(R^8)_p$ 、 X^1 、 R^{39} 及び t は前記に同じ。〕

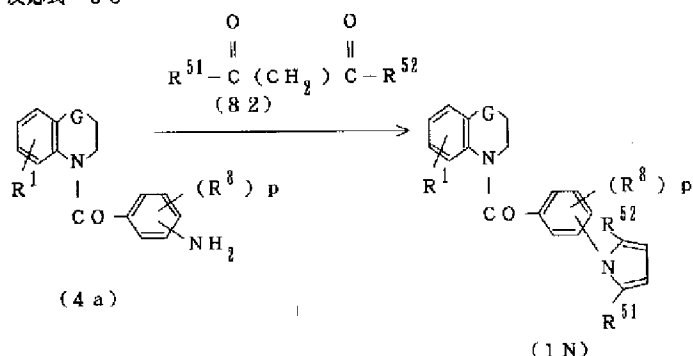
化合物(80)と化合物(81)との反応は、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(6a)との反応

と同様の^(1M)反応条件下に行われる。

【0418】

【化79】

反応式-33



【0419】〔式中、 R^1 、 G 、 R^8 及び p は前記に同じ。 R^{51} 及び R^{52} はそれぞれ低級アルキル基を示す。〕化合物(4a)と化合物(82)との反応は、適当な溶媒中、酸の存在下に行なうことができる。ここで使用される溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸、これらの混合溶媒等が挙げられる。また使用される酸としては、例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、ギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等が挙げられる。化合物(82)の使用量は、化合物(4a)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に0.5～5時間程度で終了する。

【0420】上記一般式(1)において、 R^1 が水酸基である化合物は、対応する R^1 が低級アルコキシ基である化合物を脱アルキル化反応させることにより得ることができる。この脱アルキル化反応は適当な溶媒中酸の存在下に行なわれる。溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、酢酸等の有機酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、三弗化ホウ素、塩化アルミニウム、三臭化ホウ素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。該反応は通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃にて好適に進行し、一般に0.5～15時間程度で終了する。

【0421】上記一般式(1)において、 R^9 がフェニル環上にフェニル低級アルコキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物の場合、この化合物を接触還元することにより対応する R^9 がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物に導

くことができる。該接触還元は、適当な溶媒中還元剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸、酢酸エチル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類等又はこれらの混合溶媒等を例示できる。還元剤としては、パラジウム黒、パラジウム炭素、酸化白金、白金黒、白金炭素、ラネーニッケル等の接触還元触媒を用いることができる。該反応は、通常常圧～20気圧、好ましくは常圧～10気圧の水素雰囲気中、通常-30～100℃、好ましくは0～60℃の温度で行なわれる。触媒の使用量としては、原料化合物に対して通常0.1～40重量%、好ましくは0.1～20重量%とするのがよい。

【0422】上記一般式(1)において、 R^9 がフェニル環上に低級アルカノイルオキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物又は R^9 が低級アルカノイルオキシ基を示す化合物である場合、これらの化合物を加水分解することにより対応する R^9 がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物又は R^9 が水酸基を示す化合物に導くことができる。この加水分解は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に行なうことができる。用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ギ酸、酢酸等の脂肪酸類、及びこれらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に0.5～25時間程度で終了する。

【0423】上記一般式(1)において、 R^8 が低級ア

ルコキシ基である化合物の場合、この化合物を脱アルキル化反応させることにより対応する R^9 が水酸基である化合物に導くことができる。また R^9 がフェニル環上に低級アルコキシ基を少なくとも一つ有するフェニル基を示す化合物(1)の場合も、同様に脱アルキル化反応させることにより、対応する R^9 がフェニル環上に水酸基を少なくとも一つ有するフェニル基である化合物に導くことができる。この脱アルキル化反応は、適当な溶媒中酸の存在下にて行なわれる。溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、酢酸等の有機酸、又はこれらの混合溶媒を挙げることができる。酸としては例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、三弗化ホウ素、塩化アルミニウム、三臭化ホウ素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。該反応は通常室温 $\sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは室温 $\sim 120^{\circ}\text{C}$ にて好適に進行し、一般に0.5 \sim 15時間程度で終了する。

【0424】一般式(1)の化合物において、 R^{11} がフェニル環上に置換基としてアミノ基を少なくとも一つ有するフェノキシ低級アルカノイル基を示す化合物である場合、この化合物と一般式 $R^{41}X^1$ (10a) (式中、 R^{41} は低級アルキル基を示す。 X^1 は前記に同じ。) で表わされる化合物又は一般式 $R^{16}COR^{17}$ (11) (式中、 R^{16} 及び R^{17} は前記に同じ。) で表わされる化合物とを、反応式-4における化合物(1h)と化合物(10)又は化合物(11)の反応と同様の条件下に反応させて、対応する R^{11} がフェニル環上に置換基として低級アルキル基を有するアミノ基を少なくとも一つ有するフェノキシ低級アルカノイル基である化合物に導くことができる。

【0425】一般式(1)の化合物において、 R^9 が置換又は未置換の窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1 \sim 4個有する飽和又は不飽和の5員 \sim 11員環の単環又は二項環の複素環基であって、その複素環基が骨格に二級のアミノ基を有している化合物の場合、この化合物を一般式 $R^{42}X$ (10b) (式中、 X は前記に同じ。 R^{42} は低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又は低級アルカノイル基を示す。) で表わされる化合物又は一般式 $R^{16}COR^{17}$ (11) (式中、 R^{16} 及び R^{17} は前記に同じ) で表わされる化合物と、反応式-4における化合物(1h)と化合物(10)又は化合物(11)との反応と同様の条件下に反応させて、対応する R^9 の複素環残基の二級のアミノ基に、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又は低級アルカノイル基が置換した複素環残基を有する化合物に導くことができる。また、一般式 $R^{43}OH$ (12a) (R^{43} は低級アルカノイル基を示

す。) で表わされる化合物とを、反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に反応させて、対応する R^9 の複素環残基の二級のアミノ基に低級アルカノイル基が置換した複素環残基を有する化合物に導くことができる。

【0426】本発明の化合物(1)の内、酸性基を有する化合物は、薬理的に許容し得る塩基性化合物と塩を形成し得る。かかる塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩又は重炭酸塩、ナトリウムメチラート、カリウムエチラート等のアルカリ金属アルコラート等を例示することができる。また、本発明の化合物(1)中、塩基性を有する化合物は、通常薬理的に許容される酸と容易に塩を形成し得る。かかる酸としては、例えば硫酸、硝酸、塩酸、臭化水素酸等の無機酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸、エタンスルホン酸、シユウ酸、マレイン酸、フマル酸、クエン酸、コハク酸、安息香酸等の有機酸を例示できる。之等の塩もまた遊離形態の化合物(1)と同様に本発明において有効成分化合物として用いることができる。尚、上記化合物(1)には、立体異性体、光学異性体が包含されるが、之等も同様に有効成分化合物として用いることができる。

【0427】上記各反応式に示される方法により得られる目的とする化合物は、通常分離手段により反応系内より分離され、更に精製することができる。この分離及び精製手段としては、例えば蒸留法、再結晶法、カラムクロマトグラフィー、イオン交換クロマトグラフィー、ゲルクロマトグラフィー、親和クロマトグラフィー、プレパラティブ薄層クロマトグラフィー、溶媒抽出法等を採用できる。

【0428】かくして得られる有効成分化合物は、パソプレシン拮抗剤、オキシトシン拮抗剤及びパソプレシン作働剤として有効であり、該これら薬剤は、一般的な医薬剤の形態で用いられる。薬剤は通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。この医薬剤としては各種の形態が治療目的に応じて選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。錠剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来よりよく知られている各種のものを広く使用することができる。その例としては、例えば乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カリシウム、カオリン、結晶セルロース、ケイ酸等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピ

ロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等を使用できる。さらに錠剤は必要に応じて通常の剤皮を施した錠剤、例えば糖衣錠、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。丸剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用できる。その例としては、例えばブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、カンテン等の崩壊剤等を使用できる。坐剤の形態に成形するに際しては、担体として従来公知のものを広く使用できる。その例としては、例えばポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等を挙げることができる。カプセル剤は常法に従い通常有効成分化合物を上記で例示した各種の担体と混合して硬質ゼラチンカプセル、軟質カプセル等に充填して調製される。注射剤として調製される場合、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、且つ血液と等張であるのが好ましく、これらの形態に成形するに際しては、希釈剤としてこの分野において慣用されているものをすべて使用でき、例えば水、エチルアルコール、マクロゴール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチ

7-クロロ-5-[(4-エチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-(2-メチルフェニル)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン	150g
アビセル(商標名、旭化成社製)	40g
コーンスターチ	30g
ステアリン酸マグネシウム	2g
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	10g
ポリエチレングリコール-6000	3g
ヒマシ油	40g
エタノール	40g

本発明有効成分化合物、アビセル、コーンスターチ及びステアリン酸マグネシウムを混合研磨後、糖衣R10mmのキネで打錠する。得られた錠剤をヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリエチレングリコール-6000、ヒマシ油及びエタノールからなるフィルムコーティング剤で被覆を行ない、フィルムコーティング錠を製造する。

レンソルビタン脂肪酸エステル類等を使用できる。なお、この場合等張性の溶液を調製するに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有せしめてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を添加してもよい。更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を医薬製剤中に含有させることもできる。

【0429】本発明の医薬製剤中に含有されるべき有効成分化合物の量としては、特に限定されず広範囲から適宜選択されるが、通常製剤組成物中に約1~70重量%、好ましくは約5~50重量%とするのがよい。

【0430】本発明の医薬製剤の投与方法は特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等に応じた方法で投与される。例えば錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には、経口投与される。また注射剤の場合には単独で又はブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内投与され、更に必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内投与される。坐剤の場合には直腸内投与される。

【0431】本発明医薬製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等により適宜選択されるが、通常有効成分化合物の量が、1日当たり体重1kg当たり、約0.6~50mg程度とするのが良い。また投与単位形態の製剤中には有効成分化合物が約10~1000mgの範囲で含有されるのが望ましい。

【0432】

【実施例】以下、本発明を更に詳細に説明するため、本発明医薬製剤の製剤例を挙げ、次いで該製剤に配合される有効成分化合物の製造のための原料化合物の製造例を参考例として、また上記有効成分化合物の製造例を実施例として挙げ、更に有効成分化合物の試験例を挙げる。

【0433】製剤例1

0、ヒマシ油及びエタノールからなるフィルムコーティング剤で被覆を行ない、フィルムコーティング錠を製造する。

【0434】製剤例2

7-クロロ-5-[(N-(2-ジエチルアミノエチル)-N-メチルアミノ]カルボニルメチル]-1-(3,4-ジメトキシベン

ゾイル) - 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン	150 g
クエン酸	1.0 g
ラクトース	33.5 g
リン酸ニカルシウム	70.0 g
プルロニックF-68	30.0 g
ラウリル硫酸ナトリウム	15.0 g
ポリビニルピロリドン	15.0 g
ポリエチレングリコール (カルボワックス1500)	4.5 g
ポリエチレングリコール (カルボワックス6000)	45.0 g
コーンスターチ	30.0 g
乾燥ステアリン酸ナトリウム	3.0 g
乾燥ステアリン酸マグネシウム	3.0 g
エタノール	適量

本発明有効成分化合物、クエン酸、ラクトース、リン酸ニカルシウム、プルロニックF-68及びラウリル硫酸ナトリウムを混合する。

【0435】上記混合物をNo. 60スクリーンでふるい、ポリビニルピロリドン、カルボワックス1500及び同6000を含むアルコール製溶液で湿式粒状化する。必要に応じてアルコールを添加して粉末をペースト状塊にする。コーンスターチを添加し、均一な粒子が形成されるまで混合を続ける。混合物をNo. 10スクリーンを通過させ、トレイに入れ、100℃のオーブンで12～14時間乾燥する。乾燥粒子をNo. 16スクリ

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-(2,4-ジクロロベンジルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン	5 g
ポリエチレングリコール (分子量: 4000)	0.3 g
塩化ナトリウム	0.9 g
ポリオキシエチレン-ソルビタンモノオレエート	0.4 g
メタ重亜硫酸ナトリウム	0.1 g
メチルパラベン	0.18 g
プロピルパラベン	0.02 g
注射用蒸留水	10.0 ml

上記パラベン類、メタ重亜硫酸ナトリウム及び塩化ナトリウムを攪拌しながら80℃で上記の約半量の蒸留水に溶解させる。得られた溶液を40℃まで冷却し、本発明の有効成分化合物、次いでポリエチレングリコール及びポリオキシエチレンソルビタンモノオレエートを、上記溶液中に溶解させる。次にその溶液に注射用蒸留水を加えて最終の容量に調製し、適当なフィルターペーパーを用いて滅菌濾過することにより滅菌して、注射剤を調製する。

【0438】参考例1

4-クロロメチル安息香酸メチルエステル26.36 gを1,2-ジメトキシエタン700 mlに溶解し、氷水浴上冷却攪拌下亜鉛末20.6 gとビストリフェニルホスフィンパラジウムジクロリド5 gを加えた。続いてo-トルオイルクロリド26.5 gを滴下した。反応混合

物でふるい、乾燥ラウリル硫酸ナトリウム及び乾燥ステアリン酸マグネシウムを加えて混合し、打錠機で所望の形状に圧縮する。

【0436】上記の芯部をワニスで処理し、タルクを散布し、湿気の吸収を防止する。芯部の周囲に下塗り層を被覆する。内服用のために充分な回数ワニス被覆を行なう。錠剤を完全に丸く且つ平滑にするために更に下塗り層及び平滑被覆が適用される。所望の色合が得られるまで着色被覆を行なう。乾燥後、被覆錠剤を磨いて均一な光沢の錠剤にする。

【0437】製剤例3

物は氷水浴上で3時間、室温で3日間攪拌した。不溶物を濾去し、残渣を酢酸エチル洗浄した。母液に飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、0.5 N塩酸、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: 酢酸エチル: n-ヘキサン=50:1~10:1) 後、トルエン-n-ヘキサンで再結晶し、4-[(2-メチルベンゾイル)メチル]安息香酸メチルエステル15 gを得た。

【0439】参考例2

4-メトキシカルボニルベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド19.1 g及びナトリウムメチラート2.77 gをメタノール20 mlに懸濁し、室温で1時間攪拌した。o-クロロベンズアルデヒド5 gを加え、室温で1時間攪拌後ナトリウムメチラート5.54 gを加え

更に室温で1時間攪拌した。反応混合物を濃縮後、残渣に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機相を、水、0.5 N塩酸、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣にジエチルエーテル-n-ヘキサンを加え不溶物を濾去した。母液を濃縮後残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；n-ヘキサン：酢酸エチル=30：1）で精製した。初めにメチル 4-（2-クロロスチリル）ベンゾエート（シス体）が、続いてメチル 4-（2-クロロスチリル）ベンゾエート（トランス体）が溶出してきた。シス体は2.15 g、トランス体は1.42 g、いずれも白色粉末として得た。

【0440】参考例3

メチル 4-（2-クロロスチリル）ベンゾエート（トランス体）1.42 g、5 N水酸化ナトリウム1.6 ml及びメタノール20 mlを室温で3時間、次いで2時間加熱還流した。メタノールを減圧で留去し、残渣に水を加え、次いで濃塩酸で酸性にした。室温で16時間攪拌後、析出物を濾取すると4-（2-クロロスチリル）安息香酸が白色粉末として1.36 g得られた。

【0441】参考例4

4-ブromo安息香酸7.2 g及びチオニルクロリド20 mlを1時間加熱還流後濃縮し、次に残渣にトルエンを加えて再度濃縮した。この4-ブromo安息香酸クロリドを2-アミノ-2-メチル-1-プロパノール5.1 ml、トリエチルアミン10 ml及びジクロロメタン70 mlの混合物中に、氷冷下滴下した。反応混合物を室温で5時間攪拌後、氷を加えてジクロロメタン抽出した。有機相を0.5 N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をジクロロメタン50 mlに溶解し、氷冷下、チオニルクロリド7.8 mlを滴下した。室温で3時間攪拌後氷冷にし、5 N-水酸化ナトリウム水を徐々に加えてアルカリ性にした。ジクロロメタン抽出し、有機層を水洗、硫酸マグネシウム乾燥すると、2-（4-ブromoフェニル）-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンが無色油状物として8.35 g得られた。b p 162-164°C/22 mmHg。

【0442】参考例5

マグネシウム52.6 mg及び乾燥テトラヒドロフラン50 mlを加熱還流下2-（4-ブromoフェニル）-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン1 gの乾燥テトラヒドロフラン（10 ml）溶液に滴下した。加熱を止め、ゆっくり還流する程度の速度で2-（4-ブromoフェニル）-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン4 gを滴下した。その際30分攪拌後、氷冷にしてo-トルアルデヒド2.16 mlを滴下した。氷冷で1時間、室温で2時間攪拌後、飽和塩化アンモニウム水を加えて反応を中止し、酢酸エチル抽出した。有機層を1 N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸

マグネシウム乾燥後濃縮した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー精製（溶出液；n-ヘキサン：酢酸エチル=4~2：1）により2-〔4-〔1-（2-メチルフェニル）-1-ヒドロキシメチル〕フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンを白色粉末状として3.07 g得た。

【0443】¹H-NMR（200 MHz, CDCl₃）
δ ppm：1.35（6H, s）, 2.24（3H, s）, 3.04（1H, d, J=4 Hz）, 4.08（1H, s）, 5.99（1H, d, J=4 Hz）, 7.03-7.55（6H, m）, 7.76-7.94（2H, m）。

【0444】参考例6

2-〔4-〔1-（2-メチルフェニル）-1-ヒドロキシメチル〕フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン3.0 g、二酸化マンガン20 g及びジクロロメタン50 mlを室温で混合し、室温で2時間、その後3時間加熱還流した。不溶物をセライト濾過しクロロホルム洗浄した後、母液を濃縮すると淡黄色油状物として2-〔4-（2-メチルベンゾイル）フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンを2.86 g得た。

【0445】¹H-NMR（200 MHz, CDCl₃）
δ ppm：1.40（6H, s）, 2.33（3H, s）, 4.14（2H, s）, 7.12-7.54（4H, m）, 7.76-7.92（2H, m）, 7.95-8.14（2H, m）。

【0446】参考例7

2-〔4-（2-メチルベンゾイル）フェニル〕-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン2.86 g及び4.5 M塩酸150 mlを8時間加熱還流した。室温まで冷却し、氷を加えて析出物を濾取すると4-（2-メチルベンゾイル）安息香酸が白色粉末として2.23 g得られた。

【0447】¹H-NMR（200 MHz, CDCl₃）
δ ppm：2.37（3H, s）, 7.19-7.58（4H, m）, 7.80-8.03（2H, m）, 8.10-8.35（2H, m）, 10.4（1H, br s）。

【0448】参考例8

アルゴン気流下、3-メトキシ-4-トリフルオロメチルスルホンilオキシ安息香酸メチルエステル5 gのトルエン200 ml溶液へ、テトラキス（トリフェニルフォスフィン）パラジウム0.9 gを加え、室温にて5分攪拌した。そこへ、（2-メチルフェニル）ホウ酸3.2 g、リチウムクロリド1.01 g及び2 M炭酸ナトリウム水溶液11.9 mlを加え、100°Cにて2時間攪拌した。氷を加え、パラジウムをセライト濾別し、濾液をジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を水洗乾燥後、減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；n-ヘキサン→酢酸エチル：n-ヘキサン=

1 : 1 0) に付し、4. 0 7 g の 3-メトキシ-4-(2-メチルフェニル) 安息香酸メチルエステルを油状物として得た。

【0449】¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 1 2 (3H, s), 3. 8 2 (3H, s), 3. 9 5 (3H, s), 7. 0 2~7. 4 8 (5H, m), 7. 6 3 (1H, d, J=1. 5 1 Hz), 7. 7 1 (1H, dd, J=1. 5 Hz, 7. 7 4 Hz)。

【0450】適当な出発原料を用い、参考例8と同様にして後記実施例22、23及び35~64の化合物を得た。

【0451】参考例9

アルゴン雰囲気下、2-(4-フェニル-2-メトキシフェニル)-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン3. 0 0 g をテトラヒドロフラン30 ml に溶解後、氷浴上にて冷却撹拌した。同温度にて約2モル/l n-プロピルマグネシウムプロミド-テトラヒドロフラン溶液8. 0 ml を徐々に滴下した。滴下終了後、室温に戻し16時間撹拌した。反応液を再度氷浴上にて冷却撹拌下、飽和塩化アンモニウム水溶液30 ml を加え、室温に戻した後、有機層を分取した。更に、水層より酢酸エチルで抽出(30 ml × 2)した。有機層を合わせ、飽和食塩水洗浄(100 ml × 2)後、硫酸マグネシウム上で乾燥した。溶媒を減圧留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: n-ヘキサン=1: 2→1: 1)にて精製し、溶媒を減圧留去後、2-(4-フェニル-2-n-プロピルフェニル)-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンを無色透明粘稠油として、2. 8 1 g 得た。

【0452】¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm: 0. 9 8 (3H, t, J=11. 3 Hz), 1. 3 9 (6H, s), 1. 5 2-1. 7 7 (2H, m), 2. 9 9 (2H, dd, J=7. 5 Hz, J=9. 5 Hz), 4. 0 8 (2H, s), 7. 3 0-7. 5 1 (5H, m), 7. 5 2-7. 6 3 (2H, m), 7. 7 8 (1H, d, J=6. 5 Hz)。

【0453】参考例10

濃塩酸30 ml 及び氷酢酸10 ml の混合液に2-(4-フェニル-2-n-プロピルフェニル)-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン2. 7 0 g を加え、3日間(9時間×3)加熱還流した。反応液を約2分の1に減圧濃縮後、氷浴上冷却した。析出晶を濾取し、この析出晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー精製(溶出液; ジクロロメタン→ジクロロメタン: メタノール=50: 1)し、溶媒を減圧留去後、残渣結晶をn-ヘキサンにて再結晶し、4-フェニル-2-n-プロピル安息香酸を無色針状として、1. 6 7 g 得た。

【0454】mp 107. 5~108. 5℃。

【0455】参考例11

2-(4-ブromo-2-メチルフェニル)-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン5 g の乾燥テトラヒドロフラン40 ml 溶液に、-70℃にて、1. 6 M n-ブチルリチウム14. 0 ml のn-ヘキサン溶液を滴下した。同温度で30分撹拌後、シクロヘキサノン2. 1 ml を滴下し、そのまま1時間撹拌した。水を加え、テトラヒドロフランを減圧留去した後、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=100: 1→60: 1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにて再結晶し、2-[4-(1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシル)-2-メチルフェニル]-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリンを4. 2 9 g 得た。

【0456】白色粉末状

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 1 4-1. 9 8 (11H, m), 1. 3 8 (6H, s), 2. 5 7 (3H, s), 4. 0 5 (2H, s), 7. 1 9-7. 4 5 (2H, m), 7. 7 2 (1H, d, J=8. 1 Hz)。

【0457】参考例12

2-[4-(1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシル)-2-メチルフェニル]-4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン4. 2 9 g の酢酸40 ml 溶液に10%塩酸20 ml を加え、2日間還流した。析出する結晶を濾取し、水洗、乾燥後、4-シクロヘキセニル-2-メチル安息香酸を2. 6 1 g 得た。

【0458】白色粉末状

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 5 5-1. 9 3 (4H, m), 2. 1 3-2. 3 1 及び2. 3 2-2. 5 6 (各2H, 各m), 2. 6 6 (3H, s), 6. 1 7-6. 3 4 (1H, m), 7. 1 5-7. 4 2 (2H, m), 7. 9 0-8. 1 8 (1H, m)。

【0459】参考例13

4-シクロヘキセニル-2-メチル安息香酸2. 6 1 g のエタノール30 ml 及び酢酸エチル30 ml 溶液に5%パラジウム-炭素0. 4 g を加え、水素雰囲気下、常圧下30分撹拌した。パラジウム-炭素をセライト濾別し、濾液の溶媒を減圧留去後、結晶を濾取し、アセトン-n-ヘキサンにて結晶化し、洗浄して、2. 2 7 g の4-シクロヘキシル-2-メチル安息香酸を得た。

【0460】白色粉末状

mp 129~130℃。

【0461】参考例14

N-メチルピペリドン5 ml に4-フェニルピペリンジン0. 5 g、p-フルオロベンゾニトリル0. 3 7 g 及び炭酸カリウム0. 7 8 g を溶解し、120℃で5時間撹拌した。反応液に酢酸エチル50 ml を加え、精製水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥後濾過し、

減圧下濃縮した。得られた残渣にメタノールを加え、不溶結晶を濾取し、減圧下で乾燥して4-フェニル-1-(4-シアノフェニル)ピペリジン0.39gを、白色針状として得た。

【0462】mp 167~169℃。

【0463】参考例15

4-フェニル-1-(4-シアノフェニル)ピペリジン0.39gに酢酸10ml及び濃塩酸10mlを加えて5時間還流した。反応液を濃縮し、残渣にジエチルエーテル-メタノールを加え不溶結晶を濾取し、減圧下で乾燥して4-フェニル-1-(4-カルボキシフェニル)ピペリジン0.39gを、白色粉末状として得た。

【0464】mp 257~259℃ (分解)。

【0465】参考例16

ホモピペラジン100gをエタノール500mlに溶かし、沃化エチル19.8mlを徐々に滴下した。室温で一晩攪拌した後、不溶物を濾過して除去した。溶媒を減圧下に除去した後、蒸留により精製し、1-エチルホモピペラジン50gを得た。

【0466】無色油状

bp 86~88℃/37mmHg

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:

1.06 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.68-

1.93 (2H, m), 2.54 (2H, q, $J=7.$

2Hz), 2.63-2.76 (7H, m), 2.87-3.01 (2H, m)。

【0467】参考例17

4-フェニル-2-クロロ-1-トリフルオロメチルスルホニルオキシベンゼン35gのジメチルホルムアミド300ml溶液に、一酸化炭素雰囲気下、酢酸パラジウム1.17g、1.3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン4.29g、エタノール91.5ml及びトリエチルアミン29.0mlを加え、80~90℃で6時間加熱攪拌した。反応液に水を加えてn-ヘキサンを少量加えて酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水洗乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; n-ヘキサン→酢酸エチル: n-ヘキサン=1:100)に付し、4-フェニル-2-クロロ安息香酸エチルを20.9g、無色油状物として得た。

【0468】 $^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3)

δ ppm: 1.42 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$),

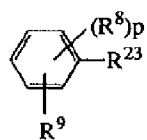
4.42 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 7.28-

7.78及び7.85-8.18 (全8H, m)。

【0469】適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にて下記の化合物を得た。

【0470】

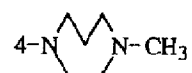
【表1】



参考例 18

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

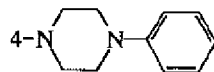
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状
形態 : 遊離

参考例 19

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状
形態 : 遊離

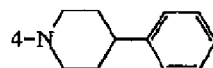
【0471】

【表2】

参考例 20

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

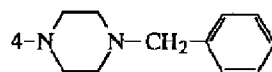
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 21

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

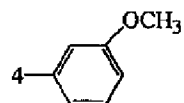
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 黄色油状
形態 : 遊離

参考例 22

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

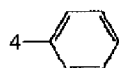
【0472】

【表3】

参考例 23

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-NO₂

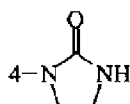
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 黄色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 24

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

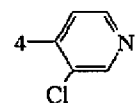
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 25

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色固体
形態 : 遊離

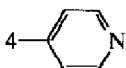
【0473】

【表4】

参考例 26

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -COOCH₃

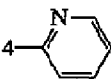
結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

参考例 27

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 96-98℃

形態 : 遊離

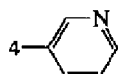
【0474】

【表5】

参考例 28

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

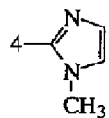
融点 : 100 - 102℃

形態 : 遊離

参考例 29

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 126 - 128℃

形態 : 遊離

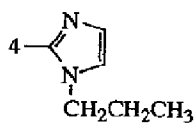
【0475】

【表6】

参考例 30

構造

R⁹ :



P :

1

R⁸ : H

R²³ :

—COOCH₃

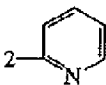
結晶形 : 褐色油状

形態 : 遊離

参考例 31

構造

R⁹ :



P :

1

R⁸ : H

R²³ :

—COOCH₃

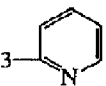
結晶形 : 淡褐色油状

形態 : 遊離

参考例 32

構造

R⁹ :



P :

1

R⁸ : H

R²³ :

—COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

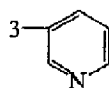
【0476】

【表7】

参考例 33

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : H

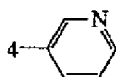
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

参考例 34

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 2-CH₃

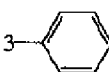
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 褐色油状
形態 : 遊離

参考例 35

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : H

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

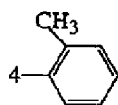
【0477】

【表8】

参考例 36

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 2-OCH₃

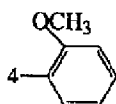
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 微黄色油状
形態 : 遊離

参考例 37

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 2-OCH₃

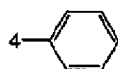
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 38

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 2-OCH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

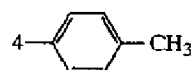
【0478】

【表9】

参考例 39

構造

R⁹ :



p : 2

R⁸ : 3, 5-di-OCH₃

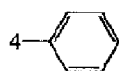
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色プリズム状
形態 : 遊離

参考例 40

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

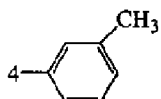
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 41

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

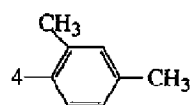
【0479】

【表10】

参考例 42

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

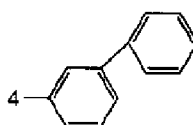
R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 43

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

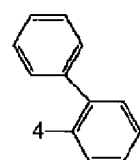
R²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 44

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

R²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

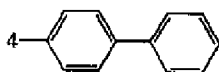
【0480】

【表11】

参考例 45

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : H

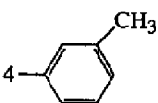
R²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 46

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 2-CH₃

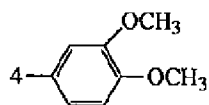
R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 微黄色油状
形態 : 遊離

参考例 47

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

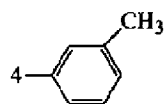
【0481】

【表12】

参考例 48

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

R²³ : -CO₂CH₃

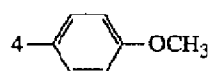
結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

参考例 49

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -CO₂CH₃

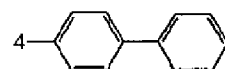
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 50

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

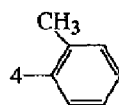
【0482】

【表13】

参考例 51

構造

R⁹ :



p :

1

R⁸ : 3-OCH₃

R²³ :

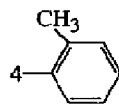
-CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 52

構造

R⁹ :



p :

2

R⁸ : 3,5-di-OCH₃

R²³ :

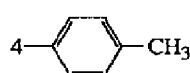
-CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 53

構造

R⁹ :



p :

1

R⁸ : 2-OCH₃

R²³ :

-CO₂CH₃

結晶形 : 無色プリズム状
形態 : 遊離

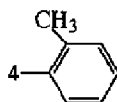
【0483】

【表14】

参考例 54

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

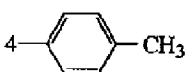
R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 55

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

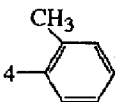
R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 56

構造

R⁹ :



p : 1

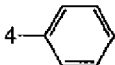
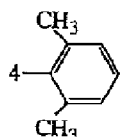
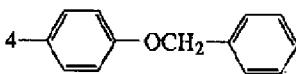
R⁸ : H

R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【0484】

【表15】

参考例 57	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ²³ :	-CO ₂ CH ₃
R ⁸ :	2-CH ₃
結晶形	無色プリズム状
形態	遊離
参考例 58	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ²³ :	-CO ₂ CH ₃
R ⁸ :	2-OCH ₃
結晶形	無色油状
形態	遊離
参考例 59	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ²³ :	-CO ₂ CH ₃
R ⁸ :	2-CH ₃
結晶形	白色粉末状
形態	遊離

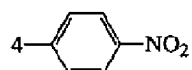
【0485】

【表16】

参考例 60

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

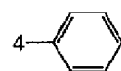
R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 微黄色粉末状
形態 : 遊離

参考例 61

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

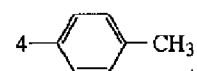
R²³ : -CO₂C₂H₅

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

参考例 62

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 微黄色粉末状
形態 : 遊離

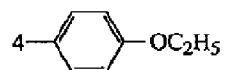
【0486】

【表17】

参考例 63

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

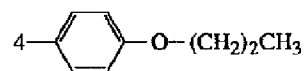
R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 64

構造

R⁹ :



p : 1

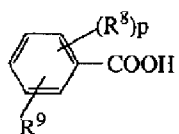
R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -CO₂CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【0487】 適当な出発原料を用い、前記参考例3、
7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

【0488】
【表18】



参考例 65

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

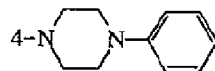
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 66

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

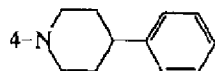
結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

参考例 67

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

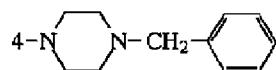
【0489】

【表19】

参考例 68

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

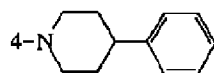
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

参考例 69

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状

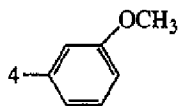
融点 : 257 - 259℃ (分解)

形態 : 遊離

参考例 70

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

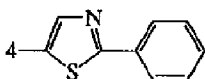
【0490】

【表20】

参考例 71

構造

R⁹ :



p : 1

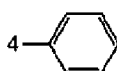
R⁸ : H

結晶形 : 褐色粉末状
形態 : 遊離
融点 : 233 - 235℃

参考例 72

構造

R⁹ :



p : 1

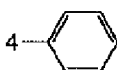
R⁸ : 2-C₂H₅

結晶形 : 無色板状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-クロロホルム
融点 : 164 - 165℃
形態 : 遊離

参考例 73

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-n-C₃H₇

結晶形 : 無色針状
結晶溶媒 : n-ヘキサン
融点 : 107.5 - 108.5℃
形態 : 遊離

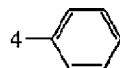
【0491】

【表21】

参考例 74

構造

R⁹ :



P : 1

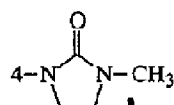
R⁸ : 2-NO₂

結晶形 : 赤褐色粉末状
融点 : 199 - 201℃
形態 : 遊離

参考例 75

構造

R⁹ :



P : 1

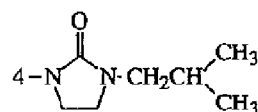
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 76

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

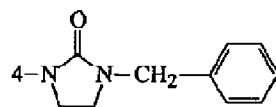
【0492】

【表22】

参考例 77

構造

R⁹ :



p : 1

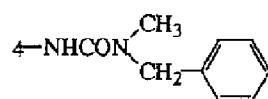
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 微赤色粉末状
形態 : 遊離

参考例 78

構造

R⁹ :



p : 1

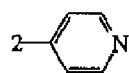
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 79

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

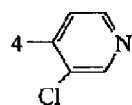
【0493】

【表23】

参考例 80

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

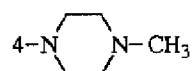
結晶形 : 白色粉末状

形態 : HCl

参考例 81

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

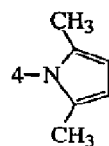
結晶形 : 褐色粉末状

形態 : 遊離

参考例 82

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 133 - 135℃

形態 : 遊離

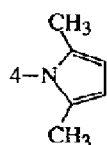
【0494】

【表24】

参考例 83

構造

R⁹ :



p : 1

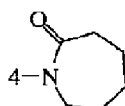
R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 褐色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム－ジエチルエーテル
融点 : 126 - 128℃
形態 : 遊離

参考例 84

構造

R⁹ :



p : 1

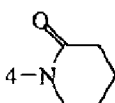
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム－ジエチルエーテル
融点 : 198 - 201℃
形態 : 遊離

参考例 85

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム－ジエチルエーテル
融点 : 236 - 239℃
形態 : 遊離

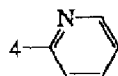
【0495】

【表2-5】

参考例 86

構造

R⁹ :



p : 1

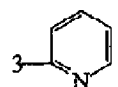
R⁸ : H

結晶形 : 白色針状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 257 - 260℃
形態 : 遊離

参考例 87

構造

R⁹ :



p : 1

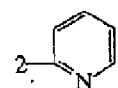
R⁸ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 201 - 203℃
形態 : 遊離

参考例 88

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 230℃ (分解)
形態 : HCl

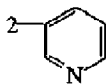
【0496】

【表26】

参考例 89

構造

R⁹ :



p : 1

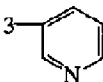
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 206 - 207℃
形態 : HCl

参考例 90

構造

R⁹ :



p : 1

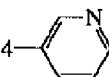
R⁸ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 266 - 269℃
形態 : HCl

参考例 91

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール
融点 : 276 - 279℃
形態 : HCl

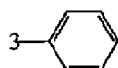
【0497】

【表27】

参考例 92

構造

R⁹ :



p : 1

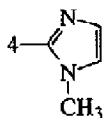
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 161 - 163℃
形態 : 遊離

参考例 93

構造

R⁹ :



p : 1

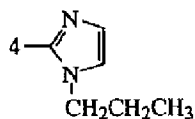
R⁸ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 250 - 251℃
形態 : 遊離

参考例 94

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

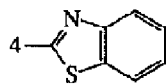
【0498】

【表28】

参考例 95

構造

R⁹ :



p : 1

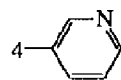
R⁸ : H

結晶形 : 白色針状
形態 : 遊離

参考例 96

構造

R⁹ :



p : 1

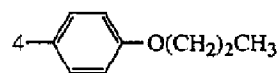
R⁸ : H

結晶形 : 淡黄色針状
再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル
融点 : 309 - 311℃
形態 : HCl

参考例 97

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 198 - 200℃
形態 : 遊離

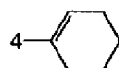
【0499】

【表29】

参考例 98

構造

R⁹ :



p : 1

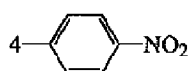
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 99

構造

R⁹ :



p : 1

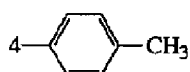
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 100

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 208℃
形態 : 遊離

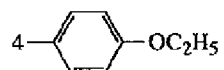
【0500】

【表3.0】

参考例 101

構造

R⁹ :



p : 1

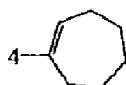
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 234 - 236℃
形態 : 遊離

参考例 102

構造

R⁹ :



p : 1

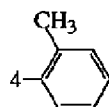
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 103

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 132 - 133℃
形態 : 遊離

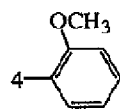
【0501】

【表3-1】

参考例 104

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

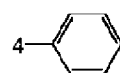
融点 : 153 - 154℃

形態 : 遊離

参考例 105

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

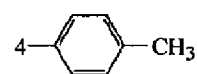
融点 : 118 - 119℃

形態 : 遊離

参考例 106

構造

R⁹ :



p : 2

R⁸ : 3, 5-di-OCH₃

再結晶溶媒 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 239 - 240℃

形態 : 遊離

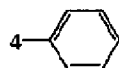
【0502】

【表32】

参考例 107

構造

R⁹ :



p : 1

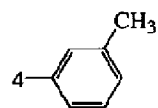
R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 179 - 182℃
形態 : 遊離

参考例 108

構造

R⁹ :



p : 1

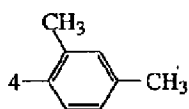
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 194 - 197℃
形態 : 遊離

参考例 109

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 149 - 150℃
形態 : 遊離

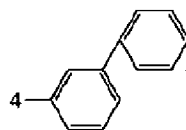
【0503】

【表33】

参考例 110

構造

R⁹ :



p :

1

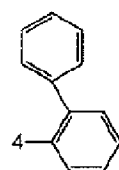
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 202 - 204℃
形態 : 遊離

参考例 111

構造

R⁹ :



p :

1

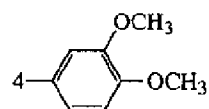
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 112

構造

R⁹ :



p :

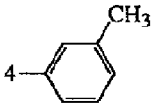
1

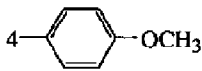
R⁸ : 2-OCH₃

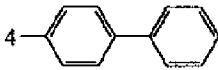
結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 134 - 135℃
形態 : 遊離

【0504】

【表34】

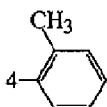
参考例 113	
構造	R ⁹ :
	
p	: 1
	R ⁸ : 2-OCH ₃
結晶形	: 白色粉末状
形態	: 遊離

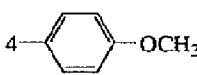
参考例 114	
構造	R ⁹ :
	
p	: 1
	R ⁸ : 2-CH ₃
結晶形	: 白色粉末状
形態	: 遊離

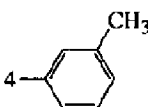
参考例 115	
構造	R ⁹ :
	
p	: 1
	R ⁸ : 2-CH ₃
結晶形	: 白色粉末状
再結晶溶媒	: エタノール—ジエチルエーテル
融点	: 262 - 265℃
形態	: 遊離

【0505】

【表35】

参考例 116		
構造		
R ⁹		
p	1	R ⁸ : 3-OCH ₃
結晶形	白色粉末状	
形態	遊離	

参考例 117		
構造		
R ⁹		
p	1	R ⁸ : 3-OCH ₃
結晶形	白色粉末状	
再結晶溶媒	アセトン- <i>n</i> -ヘキサン	
融点	146 - 147℃	
形態	遊離	

参考例 118		
構造		
R ⁹		
p	1	R ⁸ : 2-CH ₃
再結晶溶媒	白色粉末状	
再結晶溶媒	アセトン- <i>n</i> -ヘキサン	
融点	132 - 133℃	
形態	遊離	

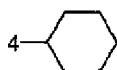
【0506】

【表36】

参考例 119

構造

R⁹ :



p : 1

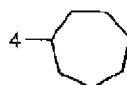
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 129 - 130℃
形態 : 遊離

参考例 120

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 121

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 淡黄色粉末状
形態 : 遊離

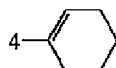
【0507】

【表37】

参考例 122

構造

R⁹ :



p : 1

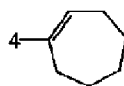
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 123

構造

R⁹ :



p : 1

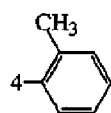
R⁸ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 124

構造

R⁹ :



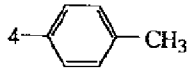
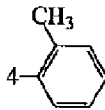
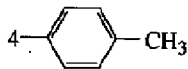
p : 2

R⁸ : 3,5-di-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 231 - 232℃
形態 : 遊離

【0508】

【表3-8】

参考例 125	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ⁸ :	2-OCH ₃
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	159 - 160℃
形態 :	遊離
参考例 126	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ⁸ :	2-CH ₃
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	アセトン-n-ヘキサン
融点 :	117 - 118℃
形態 :	遊離
参考例 127	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ⁸ :	H
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	エタノール-ジエチルエーテル
融点 :	246 - 248℃
形態 :	遊離

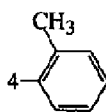
【0509】

【表39】

参考例 128

構造

R⁹ :



p : 1

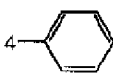
R⁸ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 185 - 187℃
形態 : 遊離

参考例 129

構造

R⁹ :



p : 1

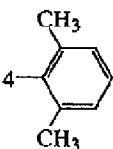
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 130

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

再結晶溶媒 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 145 - 148℃
形態 : 遊離

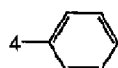
【0510】

【表40】

参考例 131

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 164℃
形態 : 遊離

【0511】 適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にして下記の化合物を得た。

【0512】

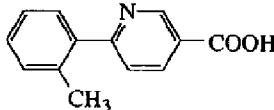
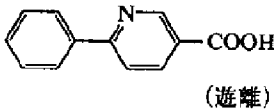
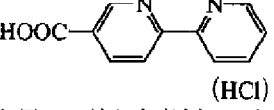
【表41】

参考例	化合物 (形態)	物性
132		白色針状 ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 200MHz) δppm: 3.97 (3H, s), 7.48-7.62 (3H, m), 7.81 (1H, dd, J=8.0Hz, J=0.8Hz), 7.98-8.17 (2H, m), 8.34 (1H, dd, J=8.0Hz, J=2.2Hz), 9.28 (1H, dd, J=2.2Hz, 0.8Hz).
133		白色粉末状 ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 200MHz) δppm: 2.38 (3H, s), 3.98 (3H, s), 7.19-7.50 (4H, m), 7.50 (1H, dd, J=0.8Hz, J=8.0Hz), 8.35 (1H, dd, J=8.0Hz, J=2.0Hz), 9.30 (1H, dd, J=0.8Hz, 2.0Hz)
134		淡褐色粉末状 融点: 110 - 111℃ 再結晶溶媒: クロロホルム-ジエチルエーテル

【0513】 適当な出発原料を用い、前記参考例3、7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

【0514】

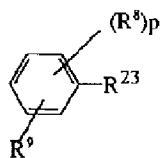
【表42】

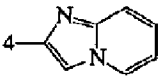
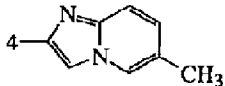


参考例	化合物 (形態)	物性
135	 (遊離)	無色針状 融点: 191 - 192℃
136	 (遊離)	無色針状 融点: 228 - 230℃
137	 (HCl)	淡褐色針状 融点: 253 - 255℃ 再結晶溶媒: メタノール-ジエチルエーテル

【0515】 適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にして下記の化合物を得た。

【0516】

【表43】



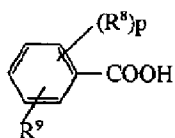
参考例	R ⁸	p	R ⁹	R ²³
138	H	1		-CO ₂ C ₂ H ₅
139	H	1		-CO ₂ C ₂ H ₅
140	H	1		-CO ₂ C ₂ H ₅
141	2-CH ₃	1		-CO ₂ CH ₃

【0517】 参考例138～参考例141で得られる化合物は、いずれも白色粉末状であった。

【0518】 適当な出発原料を用い、前記参考例3、7、10又は12と同様にして下記の化合物を得た。

【0519】

【表44】



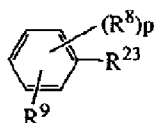
【0520】参考例142及び参考例143で得られる化合物は、いずれも白色粉末状であり、参考例144で得られる化合物は淡褐色粉末状であった。

【0521】適当な出発原料を用い、前記参考例17と同様にして下記の化合物を得た。

【0522】

【表45】

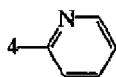
参考例	R ⁸	p	R ⁹
142	H	1	
143	H	1	
144	H	1	



参考例 145

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

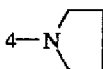
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

参考例 146

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 黄色プリズム状
形態 : 遊離

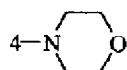
【0523】

【表46】

参考例 147

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

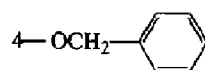
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色針状
形態 : 遊離

参考例 148

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 149

構造

R⁹ : 4-OH

p : 1

R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 97 - 98.5℃
形態 : 遊離

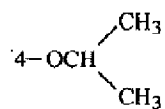
【0524】

【表47】

参考例 150

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

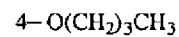
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 151

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-CH₃

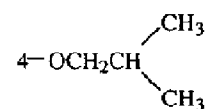
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

参考例 152

構造

R⁹ :



p : 1

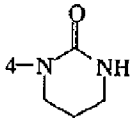
R⁸ : 2-CH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

【0525】

【表48】

参考例 153	
構造	
R ⁹ :	4-NHCOCF ₃
p :	1
R ²³ :	-COOCH ₃
結晶形 :	白色粉末状
形態 :	遊離
参考例 154	
構造	
R ⁹ :	4-OCH ₂ CO ₂ H
p :	1
R ²³ :	-COOCH ₃
結晶形 :	白色粉末状
再結晶溶媒 :	ジクロロメタン- <i>n</i> -ヘキサン
形態 :	遊離
参考例 155	
構造	
R ⁹ :	
p :	1
R ²³ :	-COOCH ₃
再結晶溶媒 :	黄色粉末状
再結晶溶媒 :	酢酸エチル- <i>n</i> -ヘキサン
融点 :	118 - 123℃
形態 :	遊離

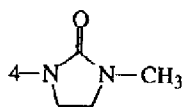
【0526】

【表49】

参考例 156

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 3-OCH₃

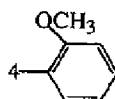
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 157

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 3-OCH₃

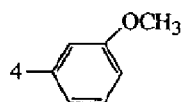
R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 158

構造

R⁹ :



P : 1

R⁸ : 3-OCH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

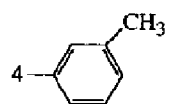
【0527】

【表50】

参考例 159

構造

R⁹ :



p : 1

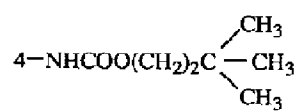
R⁸ : 3-OCH₃

R²³ : -COOCH₃

参考例 160

構造

R⁹ :



p : 1

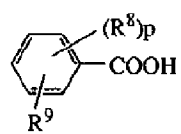
R⁸ : 2-OCH₃

R²³ : -COOCH₃

結晶形 : 無色油状
形態 : 遊離

【0528】

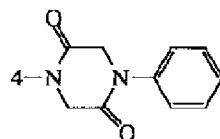
【表5-1】



参考例 161

構造

R^9 :



p :

1

R^8 : 2-CH₃

結晶形 : 淡褐色粉末状

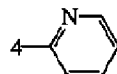
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

参考例 162

構造

R^9 :



p :

1

R^8 : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

形態 : HCl

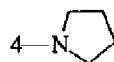
【0529】

【表52】

参考例 163

構造

R⁹ :



p :

1

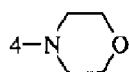
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : HCl

参考例 164

構造

R⁹ :



p :

1

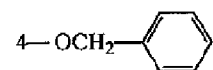
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 165

構造

R⁹ :



p :

1

R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 : 127.5 - 130℃
形態 : 遊離

【0530】

【表53】

参考例 166		
構造		
R ⁹	:	$4-O-\underset{\text{CH}_3}{\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}}$
p	:	1
		R ⁸ : 2-CH ₃
結晶形	:	白色粉末状
形態	:	遊離
参考例 167		
構造		
R ⁹	:	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃
p	:	1
		R ⁸ : 2-CH ₃
結晶形	:	白色粉末状
形態	:	遊離
参考例 168		
構造		
R ⁹	:	$4-OCH_2\underset{\text{CH}_3}{\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}}$
p	:	1
		R ⁸ : 2-CH ₃
結晶形	:	淡黄色粉末状
形態	:	遊離

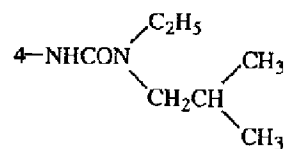
【0531】

【表54】

参考例 169

構造

R⁹ :



p : 1

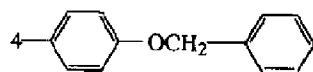
R⁸ : 2-Cl

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 170

構造

R⁹ :



p : 1

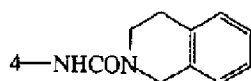
R⁸ : 2-CH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

参考例 171

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-Cl

再結晶溶媒 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【0532】

【表5.5】

参考例 172	
構造	$R^9 : \begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ 4-\text{CH}_2\text{CH} \\ \diagdown \\ \text{CH}_3 \end{array}$
p	1
	$R^8 : 2-\text{CH}_3$
結晶形	白色粉末状
形態	遊離
参考例 173	
構造	$R^9 : \begin{array}{c} \text{N} \\ \diagup \\ 4- \\ \diagdown \\ \text{N} \end{array}$
p	1
	$R^8 : 2-\text{CH}_3$
結晶形	黄色粉末状
形態	遊離
参考例 174	
構造	$R^9 : \begin{array}{c} \text{NHCON} \\ \diagup \\ 4- \\ \diagdown \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{C}_6\text{H}_4 \end{array}$
p	1
	$R^8 : 3-\text{OCH}_3$
結晶形	白色粉末状
形態	遊離

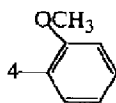
【0533】

【表56】

参考例 175

構造

R⁹ :



p : 1

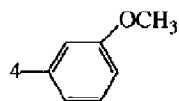
R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 170 - 171℃
形態 : 遊離

参考例 176

構造

R⁹ :



p : 1

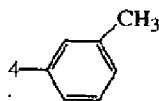
R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 128 - 129℃
形態 : 遊離

参考例 177

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 3-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 146 - 147℃
形態 : 遊離

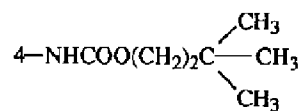
【0534】

【表5.7】

参考例 178

構造

R⁹ :



p : 1

R⁸ : 2-OCH₃

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【0535】上記で得られる各参考例化合物のNMRスペクトルは、次の通りである。

【0536】参考例18の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.90-3.06 [全9H, m, 2.38 (s)],
3.30-3.72 (4H, m), 3.85 (3H, s),
6.35-6.81 [全2H, m, 6.53 (dd, $J=8.93\text{Hz}$, $J=8.99\text{Hz}$), 6.67 (d, $J=2.32\text{Hz}$)], 7.83 (1H, d, $J=8.95\text{Hz}$)。

【0537】参考例19の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.92-3.60 (全8H, m), 3.88 (3H, s),
6.79-7.48及び7.78-7.79 [全8H, m, 6.79 (dd, $J=8.92\text{Hz}$, $J=8.92\text{Hz}$)]。

【0538】参考例20の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.68-2.09 [全4H, m, 1.77 (d, $J=3.30\text{Hz}$), 1.84 (d, $J=4.20\text{Hz}$)],
2.61-3.12 (全3H, m), 3.75-4.10 [全5H, m, 3.87 (s)], 6.78 (1H, dd, $J=8.96\text{Hz}$, $J=8.97\text{Hz}$),
6.92 (1H, d, $J=2.58\text{Hz}$), 7.15-7.41 (全5H, m), 7.86 (1H, d, $J=8.92\text{Hz}$)。

【0539】参考例21の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.57 (3H, t, $J=5.21\text{Hz}$), 3.31 (3H, t, $J=5.23\text{Hz}$), 3.55 (2H, s),
3.86 (3H, s), 6.72 (1H, dd, $J=8.95\text{Hz}$, $J=8.94\text{Hz}$), 6.85 (1H, d, $J=2.56\text{Hz}$), 7.19-7.49 (5H, m),
7.82 (1H, d, $J=8.91\text{Hz}$)。

【0540】参考例22の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.66 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.89 (3H, s),
6.81-7.60 (6H, m), 7.85-8.08 (1H, m)。

【0541】参考例23の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
3.94 (3H, s), 7.39-7.70 (5H, m),
7.79-7.92 (2H, m), 8.02-8.11 (1H, m)。

【0542】参考例24の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
3.4-3.55 (2H, m), 3.8 (3H, s),
3.8-3.95 (2H, m), 7.36 (1H, s),
7.50 (1H, dd, $J=8.8\text{Hz}$, $J=2\text{Hz}$),
7.82 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$),

7.86 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)。

【0543】参考例25の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.67 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.22-7.43 (3H, m),
7.95-8.08 (1H, m), 8.48-8.63 (1H, m),
8.65-8.75 (1H, m)。

【0544】参考例26の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.69 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.41-7.63 (4H, m),
7.95-8.08 (1H, m), 8.62-8.76 (2H, m)。

【0545】参考例30の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.88 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.05 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$),
1.80 (3H, hept, $J=7.4\text{Hz}$), 4.00 (2H, t, $J=7.4\text{Hz}$),
4.31 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 7.06 (1H, d, $J=1.1\text{Hz}$),
7.17 (1H, d, $J=1.1\text{Hz}$), 7.60-7.76 (2H, m),
8.06-8.22 (2H, m)。

【0546】参考例31の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
3.68 (3H, s), 7.20-7.36 (1H, m),
7.40-7.66 (4H, m), 7.66-7.90 (2H, m),
8.58-8.74 (1H, m)。

【0547】参考例32の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
3.96 (3H, s), 7.22-7.35 (1H, m),
7.56 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.72-7.86 (2H, m),
8.09 (1H, dt, $J=1.5\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$), 8.24 (1H, dd, $J=1.2\text{Hz}$, $J=1.8\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$),
8.65 (1H, t, $J=1.6\text{Hz}$), 8.69-8.77 (1H, m)。

【0548】参考例33の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
3.96 (3H, s), 7.39 (1H, ddd, $J=0.8\text{Hz}$, $J=4.8\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$),
7.57 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.75-7.83 (1H, m),
7.87-7.97 (1H, m), 8.08 (1H, dt, $J=1.3\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$),
8.27 (1H, t, $J=1.6\text{Hz}$), 8.63 (1H, dd, $J=1.6\text{Hz}$, $J=4.8\text{Hz}$),
8.88 (1H, dd, $J=0.7\text{Hz}$, $J=2.4\text{Hz}$)。

【0549】参考例34の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.69 (3H, s), 3.92 (3H, s), 7.3

2-7. 53 (3H, m), 7. 89 (1H, d d d, J=1. 7Hz, J=2. 3Hz, J=7. 1Hz), 8. 03 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 63 (1H, d d, J=1. 6Hz, J=4. 8Hz), 8. 86 (1H, d d, J=0. 7Hz, J=1. 6Hz)。

【0550】参考例35の化合物

¹H-NMR (250MHz, CDCl₃) δ ppm: 3. 95 (3H, s), 7. 32-7. 56 (4H, m), 7. 59-7. 66 (2H, m), 7. 75-7. 83 (1H, m), 7. 99-8. 07 (1H, m), 8. 25-8. 33 (1H, m)。

【0551】参考例36の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 27 (3H, s), 3. 91 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 6. 86-7. 04 (2H, m), 7. 16-7. 41 (4H, m), 7. 76-7. 96 (1H, m)。

【0552】参考例37の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 3. 81, 3. 90及び3. 93 (各3H, 各s), 6. 87-7. 23 (4H, m), 7. 29-7. 52 (2H, m), 7. 76-7. 92 (1H, m)。

【0553】参考例38の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 3. 91及び3. 97 (各3H, 各s), 7. 11-7. 28 (2H, m), 7. 32-7. 55 (3H, m), 7. 56-7. 70 (2H, m), 7. 89 (1H, d, J=8. 0Hz)。

【0554】参考例39の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 39 (3H, s), 3. 79 (6H, s), 3. 95 (3H, s), 7. 23 (4H, s), 7. 33 (2H, s)。

【0555】参考例40の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 3. 87及び3. 94 (各3H, 各s), 7. 21-7. 50 (4H, m), 7. 51-7. 61 (2H, m), 7. 62-7. 83 (2H, m)。

【0556】参考例41の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 43及び3. 94 (各3H, 各s), 7. 08-7. 29 (1H, m), 7. 30-7. 50 (3H, m), 7. 58-7. 72 (2H, m), 8. 02-8. 18 (2H, m)。

【0557】参考例42の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 24, 2. 37, 3. 90及び3. 91 (各3H, 各s), 6. 78-6. 98 (2H, m), 7. 00-7. 19 (3H, m), 7. 73-7. 90 (1H, m)。

【0558】参考例43の化合物

¹H-NMR (250MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 42 (3H, t, J=7. 1Hz), 4. 41 (2H, q, J=7. 1Hz), 7. 27-7. 90及び8. 02-8. 22 (全13H, m)。

【0559】参考例44の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 37 (3H, t, J=7. 1Hz), 4. 34 (2H, q, J=7. 1Hz), 7. 01-7. 31及び7. 32-7. 68 (全11H, m), 7. 79-8. 00 (2H, m)。

【0560】参考例45の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 47 (3H, t, J=7Hz), 4. 41 (2H, q, J=7Hz), 7. 29-7. 57, 7. 58-7. 84及び8. 03-8. 21 (全13H, m)。

【0561】参考例46の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 42 (3H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 91 (3H, s), 7. 07-7. 59 (6H, m), 7. 87-8. 11 (1H, m)。

【0562】参考例47の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 3. 91, 3. 94, 3. 97及び3. 98 (各3H, 各s), 6. 96 (1H, d, J=8. 3Hz), 7. 03-7. 24 (4H, m), 7. 88 (1H, d, J=7. 9Hz)。

【0563】参考例48の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 43, 3. 91及び3. 98 (各3H, 各s), 7. 04-7. 29 (3H, m), 7. 30-7. 51 (3H, m), 7. 88 (1H, d, J=7. 9Hz)。

【0564】参考例49の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 67 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 90 (3H, s), 6. 90-7. 08 (2H, m), 7. 35-7. 49 (2H, m) 及び7. 50-7. 66 (2H, m), 7. 89-8. 07 (1H, m)。

【0565】参考例50の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 69 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 7. 27-7. 81及び7. 95-8. 11 (全12H, m)。

【0566】参考例51の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 12 (3H, s), 3. 82 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 7. 02-7. 48 (5H, m), 7. 63 (1H, d, J=1. 4Hz), 7. 71 (1H, d d, J=7. 7Hz, J=1. 4Hz)。

【0567】参考例52の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.05 (3H, s), 3.77 (6H, s), 3.96 (3H, s), 7.03–7.18 (1H, m), 7.19–7.32 (3H, m), 7.34 (2H, s)。

【0568】参考例53の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.40, 3.90及び3.97 (各3H, 各s), 7.09–7.34 (4H, m), 7.42–7.59 (2H, m), 7.87 (1H, d, $J=7.9\text{Hz}$)。

【0569】参考例54の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.26, 2.65及び3.91 (各3H, 各s), 7.08–7.38 (6H, m), 7.89–8.02 (1H, m)。

【0570】参考例55の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.41及び3.93 (各3H, 各s), 7.17–7.34 (2H, m), 7.46–7.57 (2H, m), 7.58–7.72 (2H, m), 8.02–8.16 (2H, m)。

【0571】参考例56の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.26及び3.94 (各3H, 各s), 7.14–7.35 (4H, m), 7.36–7.52 (2H, m), 7.99–8.18 (2H, m)。

【0572】参考例57の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.68 (3H, s), 3.91 (3H, s), 7.29–7.54及び7.55–7.72 (全7H, m), 7.91–8.08 (1H, m)。

【0573】参考例58の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.04 (6H, s), 3.88及び3.92 (各3H, 各s), 6.71–6.85 (2H, m), 7.06–7.48 (3H, m), 7.78–7.93 (1H, m)。

【0574】参考例59の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.66 (3H, s), 3.90 (3H, s), 5.12 (2H, s), 6.98–7.12 (2H, m), 7.20–7.68 (10H, m)。

【0575】参考例60の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.70 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.38–7.58 (2H, m), 7.68–7.87 (2H, m), 7.98–8.12 (1H, m), 8.21–8.46 (2H, m)。

【0576】参考例61の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.42 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 4.42 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 7.28–7.78及び7.85–8.18 (全8H, m)。

【0577】参考例62の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.40 (3H, s), 2.67 (3H, s), 3.90 (3H, s), 7.18–7.31 (2H, m), 7.37–7.58 (4H, m), 7.91–8.05 (1H, m)。

【0578】参考例63の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.44 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 2.66 (3H, s), 3.90 (3H, s), 4.10 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 6.88–7.06 (2H, m), 7.34–7.49 (2H, m), 7.50–7.64 (2H, m), 7.89–8.06 (1H, m)。

【0579】参考例64の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.06 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.70–1.97 (2H, m), 2.66 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.97 (2H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 6.89–7.08 (2H, m), 7.35–7.48 (2H, m), 7.49–7.64 (2H, m), 7.89–8.08 (1H, m)。

【0580】参考例65の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1.40–2.90及び3.21–3.90 [全3H, m, 2.33 (s)], 6.50–8.40 [全4H, m, 7.71 (d, $J=8.41\text{Hz}$)]。

【0581】参考例66の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.85–4.90 (全9H, m), 6.79–7.38及び7.45–7.69 (全7H, m)。

【0582】参考例68の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.60–4.75 (全11H, m), 6.80–7.85 [全8H, m, 7.77 (d, $J=8.80\text{Hz}$)]。

【0583】参考例70の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.74 (3H, s), 3.88 (3H, s), 5.82–8.39 [全8H, m, 6.95 (d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.15 (d, $J=8.52\text{Hz}$)]。

【0584】参考例75の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.77 (3H, s), 3.42–3.50 (2H, m), 3.78–3.86 (2H, m), 7.49

(1H, dd, J=8.8Hz, J=2.2Hz), 7.83 (1H, d, J=8.8Hz), 7.84 (1H, d, J=2.2Hz), 12.6-13.3 (1H, m)。

【0585】参考例76の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 0.86 (6H, d, J=6.6Hz), 1.8-2.05 (1H, m), 3.0 (2H, d, J=7.2Hz), 3.4-3.55 (2H, m), 3.8-3.95 (2H, m), 7.49 (1H, dd, J=8.8Hz, J=2.2Hz), 7.83 (1H, d, J=8.8Hz), 7.85 (1H, d, J=2.2Hz), 12.8-13.1 (1H, m)。

【0586】参考例77

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 3.3-3.41 (2H, m), 3.75-3.95 (2H, m), 4.39 (2H, s), 7.2-7.45 (5H, m), 7.5 (1H, dd, J=9Hz, J=2.2Hz), 7.84 (1H, d, J=9Hz), 7.88 (1H, d, J=2.2Hz)。

【0587】参考例78の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.93 (3H, s), 4.56 (2H, s), 7.20-7.50 (5H, m), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.81 (2H, d, J=8.7Hz), 8.76 (1H, s)。

【0588】参考例79の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 7.38-7.51 (1H, m), 7.51-7.95 (4H, m), 7.95-8.10 (1H, m), 8.68-7.95 (2H, m), 10.3-13.5 (1H, br)。

【0589】参考例80の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.58 (3H, s), 7.38-7.48 (2H, m), 7.48-7.64 (1H, m), 7.46-8.01 (1H, m), 8.63 (1H, d, J=5.0Hz), 8.80 (1H, s)。

【0590】参考例81の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.22 (3H, s), 2.30-2.58 (4H, m), 3.15-3.40 (4H, m), 6.85-7.05 (2H, m), 7.15-7.84 (2H, m), 11.75-12.80 (1H, brs)。

【0591】参考例94の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 0.77 (3H, t, J=7.3Hz), 1.75 (2H, q, J=7.3Hz), 4.15 (2H, t, J=7.3Hz), 7.31-7.97 (3H, m), 8.02 (1H, d, J=1.7Hz), 8.11-

8.27 (2H, m)。

【0592】参考例95の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 7.19 (1H, s), 7.35-7.64 (2H, m), 7.69 (1H, s), 8.00-8.30 (4H, m), 10.40-11.62 (1H, brs)。

【0593】参考例98の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-1.94 (4H, m), 2.13-2.30 (2H, m), 2.31-2.56 (2H, m), 2.66 (3H, s), 6.18-6.35 (1H, m), 7.15-7.42 (2H, m), 7.90-8.18 (1H, m)。

【0594】参考例99の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.62 (3H, s), 7.58-7.82 (2H, m), 7.88-8.19 (3H, m), 8.21-8.48 (2H, m), 12.97 (1H, s)。

【0595】参考例102の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.42-2.00 (6H, m), 2.18-2.46 (2H, m), 2.47-2.79 (2H, m), 2.66 (3H, s), 6.21 (1H, t, J=6.7Hz), 7.05-7.40 (1H, m), 7.88-8.12 (1H, m)。

【0596】参考例111の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.03-7.31 (7H, m), 7.32-7.58 (4H, m), 7.95 (2H, d, J=8.35Hz)。

【0597】参考例113の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.30及び4.15 (各3H, 各s), 7.09-7.48 (6H, m), 8.23 (1H, d, J=8.1Hz), 10.00-11.42 (1H, m)。

【0598】参考例114の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.73及び3.87 (各3H, 各s), 7.00及び7.59 (各2H, 各dd, J=8.8Hz, J=2.1Hz), 7.36-7.52 (2H, m), 8.03-8.21 (1H, m)。

【0599】参考例116の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.14及び3.85 (各3H, 各s), 7.09-7.41 (5H, m), 7.71 (1H, d, J=1.4Hz), 7.82 (1H, dd, J=8.0Hz, J=1.5Hz)。

【0600】参考例120の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm:

1. 21-2. 06及び2. 48-2. 82 (全13 H, m), 2. 63 (3H, s), 4. 84-6. 49 (1H, m), 6. 98-7. 19 (2H, m), 7. 99 (1H, d, J=8. 7 Hz)。

【0601】参考例121の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 40-2. 23及び2. 87-3. 14 (全9H, m), 2. 64 (3H, s), 6. 98-7. 24 (2H, m), 8. 00 (1H, d, J=8. 7 Hz)。

【0602】参考例122の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 49-1. 88 (4H, m), 2. 08-2. 19及び2. 20-2. 52 (各2H, 各m), 6. 20-6. 40 (1H, m), 7. 51及び7. 87 (各2H, 各d, 各J=8. 4 Hz), 12. 42-13. 18 (1H, m)。

【0603】参考例123の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 49-1. 68 (4H, m), 1. 69-1. 91 (2H, m), 2. 18-2. 37 (2H, m), 2. 45-2. 67 (2H, m), 6. 23 (1H, t, J=6. 7 Hz), 7. 42及び7. 86 (各2H, 各d, 各J=8. 4 Hz), 7. 28-7. 79 (1H, m)。

【0604】参考例129の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 75 (3H, m), 7. 29-7. 74 (7H, m), 8. 10-8. 22 (1H, m)。

【0605】参考例138の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 34 (3H, t, J=7. 2 Hz), 4. 33 (2H, q, J=7. 2 Hz), 6. 80-6. 95 (1H, m), 7. 20-7. 35 (1H, m), 7. 55-7. 65 (1H, m), 7. 98-8. 16 (4H, m), 8. 45-8. 60 (2H, m)。

【0606】参考例139の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 34 (3H, t, J=7. 2 Hz), 2. 29 (3H, s), 4. 33 (2H, q, J=7. 2 Hz), 7. 10-7. 20 (1H, m), 7. 50-7. 58 (1H, m), 7. 95-8. 15 (4H, m), 8. 33 (1H, s), 8. 43 (1H, s)。

【0607】参考例140の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 40 (3H, t, J=7. 2 Hz), 4. 21 (2H, s), 4. 37 (2H, q, J=7. 2 Hz), 7. 60-7. 70 (2H, m), 8. 00-8. 11 (2H, m), 8. 42 (1H, br s)。

【0608】参考例141の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm:

2. 61 (3H, s), 3. 88 (3H, s), 4. 20 (2H, s), 7. 40-7. 55 (2H, m), 7. 90-8. 01 (1H, m), 8. 30 (1H, br s)。

【0609】参考例142の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 7. 40-7. 55 (1H, m), 7. 85-8. 03 (2H, m), 8. 03-8. 25 (4H, m), 8. 85-9. 00 (2H, m), 12. 4-14. 1 (1H, br s)。

【0610】参考例143の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2. 41 (3H, s), 7. 75-7. 95 (2H, m), 7. 95-8. 25 (4H, m), 8. 70 (1H, s), 8. 85 (1H, s), 12. 6-13. 6 (1H, br s)。

【0611】参考例144の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 07 (6H, s), 5. 94 (2H, s), 7. 30-7. 40 (2H, m), 8. 20-8. 30 (2H, m), 10. 7-12. 1 (1H, br s)。

【0612】参考例145の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 70 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 7. 22-7. 35 (1H, m), 7. 70-7. 96 (4H, m), 8. 03 (1H, d, J=8. 2 Hz), 8. 67-8. 78 (1H, m)。

【0613】参考例146の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 92-2. 18及び3. 21-3. 45 (全8H, m), 3. 85 (3H, s), 6. 38 (1H, dd, J=2. 5 Hz, J=2. 5 Hz), 6. 52 (1H, d, J=2. 45 Hz), 7. 88 (1H, d, J=11. 3 Hz)。

【0614】参考例147の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 3. 29 (4H, t, J=4. 8 Hz), 3. 84 (4H, t, J=5. 1 Hz), 3. 87 (3H, s), 6. 73 (1H, dd, J=2. 8 Hz, 2. 6 Hz), 6. 86 (1H, d, J=2. 7 Hz), 7. 85 (1H, d, J=9. 0 Hz)。

【0615】参考例148の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 60 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 5. 09 (2H, s), 6. 72-6. 99 [2H, m, 6. 83 (1H, s)], 7. 25-7. 48 (5H, m), 7. 93 (1H, d, J=9. 1 Hz)。

【0616】参考例150の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 35 (6H, d, J=6. 1 Hz), 2. 59 (3

H, s), 3.85 (3H, m), 4.49–4.71 (1H, m), 6.61–6.78 (2H, m), 7.82–7.98 (1H, m)。

【0617】参考例151の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.98 (3H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 1.30–1.89 (4H, m), 2.59 (3H, s), 3.85 (3H, s), 4.13 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 6.68–6.80 (2H, m), 7.83–7.99 (1H, m)。

【0618】参考例152の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.03 (6H, d, $J=6.7\text{Hz}$), 1.98–2.21 (1H, m), 2.59 (3H, s), 3.75 (2H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 3.85 (3H, s), 6.66–6.81 (2H, m), 7.82–7.99 (1H, m)。

【0619】参考例153の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.94 (3H, s), 7.58 (1H, dd, $J=8.6, 2.2\text{Hz}$), 7.78 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.90 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.32 (1H, brs)。

【0620】参考例154の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 2.50 (3H, s), 3.78 (3H, s), 4.75 (2H, s), 6.73–6.93 (2H, m), 7.82 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 13.09 (1H, brs)。

【0621】参考例156の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.88 (3H, s), 3.41–3.50 (2H, m), 3.79–3.89 (2H, m), 3.89 (3H, s), 3.90 (3H, s), 7.49 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 7.65 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}, 1.7\text{Hz}$)。

【0622】参考例157の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.77, 3.83及び3.93 (各3H, 各s), 6.89–7.08 (2H, m), 7.15–7.44 (3H, m), 7.54–7.79 (2H, m)。

【0623】参考例158の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.84, 3.88及び3.94 (各3H, 各s), 6.83–6.98 (1H, m), 7.02–7.18 (2H, m), 7.27–7.43 (2H, m), 7.64 (1H, d, $J=1.4\text{Hz}$), 7.71 (1H, dd, $J=1.6\text{Hz}, 7.8\text{Hz}$)。

【0624】参考例160の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.79–1.02 [9H, m, 0.96 (s)], 1.59 (2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 3.86 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.23 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 6.90 (1H, dd, $J=8.5\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$), 7.03 (1H, s), 7.43 (1H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 7.80 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$)。

【0625】参考例161の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 2.55 (3H, s), 4.53 (2H, s), 4.55 (2H, s), 7.25–7.55 (7H, m), 7.88 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 12.88 (1H, s)。

【0626】参考例162の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 2.62 (3H, s), 7.70–7.82 (1H, m), 7.90–8.13 (3H, m), 8.20–8.40 (2H, m), 8.72–8.86 (1H, m)。

【0627】参考例163の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.85–2.12 (4H, m), 3.12–3.46 (4H, m), 6.35–6.62 (2H, m), 7.74 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 12.35 (1H, brs)。

【0628】参考例164の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 3.25 (4H, t, $J=5.0\text{Hz}$), 3.70 (4H, t, $J=5.0\text{Hz}$), 6.80–7.09 (2H, m), 7.75 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$)。

【0629】参考例166の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.26 (6H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 2.49 (3H, s), 4.56–4.80 (1H, m), 6.69–6.85 (2H, m), 7.75–7.85 (1H, m), 12.39 (1H, s)。

【0630】参考例167の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 0.93 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.33–1.55 (2H, m), 1.57–1.81 (2H, m), 2.51 (3H, s), 4.01 (2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 6.72–6.90 [2H, m, 6.83 (1H, s)], 7.82 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 12.41 (1H, s)。

【0631】参考例168の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 0.96 (6H, d, $J=6.7\text{Hz}$), 1.87–2.15 (1H, m), 2.50 (3H, s), 3.

7.8 (2H, d, $J=6.5\text{ Hz}$), 6.72–6.88 [2H, m, 6.82 (1H, s)], 7.81 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 12.40 (1H, br s)。

【0632】参考例169の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.97 (6H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 1.23 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.85–2.10 (1H, m), 3.13 (2H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 3.39 (2H, q, $J=7\text{ Hz}$), 6.54 (1H, s), 7.36 (1H, dd, $J=8.7\text{ Hz}$, 2.2 Hz), 7.63 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.98 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

【0633】参考例170の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.57 (3H, s), 5.17 (2H, s), 6.58–6.92及び6.93–8.03 (全12H, m), 12.56–12.94 (1H, m)。

【0634】参考例171の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.84 (2H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 3.70 (2H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 4.64 (2H, s), 7.17 (4H, s), 7.54 (1H, dd, $J=7\text{ Hz}$, 1.6 Hz), 7.76–7.83 (2H, m), 9.01 (1H, s)。

【0635】参考例172の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0.83 (6H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 1.68–1.97 (1H, m), 2.42 (2H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.48 (3H, s), 6.93–7.13 (2H, m), 7.74 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【0636】参考例173の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.61 (3H, s), 4.10–5.40 (2H, br s), 7.32–7.90 (4H, m), 7.95 (1H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 9.22 (1H, d, $J=5.8\text{ Hz}$)。

【0637】参考例174の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.86 (2H, t, $J=5.8\text{ Hz}$), 3.67 (2H, t, $J=5.8\text{ Hz}$), 3.89 (3H, s), 4.63 (2H, s), 7.18 (4H, s), 7.4–7.6 (2H, m), 7.84 (1H, s), 7.95 (1H, d, $J=8.2\text{ Hz}$)。

【0638】参考例178の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0.93 (9H, s), 1.55 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 3.76 (3H, s), 4.15 (2H, t, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.05 (1H, dd, $J=8.6\text{ Hz}$, 8.6 Hz), 7.64 (1H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 7.34 (1H, d, $J=1.6\text{ Hz}$), 9.88 (1H, s)。

＝8.6 Hz, 8.6 Hz), 7.64 (1H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 7.34 (1H, d, $J=1.6\text{ Hz}$), 9.88 (1H, s)。

【0639】実施例1

4-エトキシ-2-メトキシ安息香酸0.33gを塩化チオニル10mlに溶かし、30分間加熱還流した。このものを減圧下に濃縮後、トルエン20mlを加えて再び減圧下濃縮した。得られた4-エトキシ-2-メトキシベンゾイルクロリドをジクロロメタン10mlに溶かした後、氷浴上で0℃に冷却し、7-クロロ-5-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノ]カルボニルメチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.5gを加えた。続いて、トリエチルアミン0.6mlを加え、そのままの温度で2時間攪拌した。反応物に水を加えてジクロロメタンにて抽出後、炭酸ナトリウムにて乾燥した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール＝50:1～5:1)にて精製した。得られた油状物をエタノールに溶かし、濃塩酸0.1mlを加え、減圧下に濃縮することにより7-クロロ-5-[N-メチル-N-(2-ジエチルアミノエチル)アミノ]カルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-エトキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンの塩酸塩を無色不定形物として得た(0.2g)。

【0640】 $^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0.98–2.06 (13H, m), 2.61–4.88 (21H, m), 6.18–7.45 (6H, m), 10.42–11.52 (1H, m)。

【0641】実施例2

4-シクロヘキシル安息香酸2gに塩化チオニル20mlを加え、2時間加熱還流した。塩化チオニルを留去し、4-シクロヘキシルベンゾイルクロリドを得た。5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2.2gのジクロロメタン50ml溶液にピリジン3.3gを加え、次いで氷冷攪拌下先の4-シクロヘキシルベンゾイルクロリドを加え、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、ジクロロメタンにて抽出した。希塩酸で洗浄、水洗後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン)にて精製して、5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン4gを得た。

【0642】無色油状

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.27 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 1.20–2.20 (14H, m), 2.30–2.50 (1H,

m), 2.60-3.05 (3H, m), 3.10-3.35 (1H, m), 4.10-4.40 (2H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 6.57 (1H, d, J=8.4Hz), 6.96 (1H, d, J=8.1Hz), 7.00 (2H, d, J=8.0Hz), 7.10-7.35 (3H, m)。

【0643】実施例3

5-エトキシカルボニルメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2gのエタノール20ml溶液に5N水酸化ナトリウム水溶液5mlを加え、室温にて終夜攪拌した。反応液に塩酸を加えて酸性とした後、ジクロロメタンで抽出、水洗後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去して、5-カルボキシメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン1.8gを得た。

【0644】無色不定形

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.20-2.25 (14H, m), 2.30-2.55 (1H, m), 2.60-3.30 (3H, m), 3.50-3.90 (1H, m), 4.45-4.60 及び 5.10-5.30 (1H, m), 6.15 (1H, br s), 6.59 (1H, d, J=8.3Hz), 6.85-7.00 (3H, m), 7.10-7.35 (3H, m)。

【0645】適当な出発原料を用い、実施例3と同様にして下記実施例52、68、77、78、81~83、87、90、96、101、103、104、109、117~118、120及び131~135の化合物を得た。

【0646】実施例4

5-カルボキシメチル-7-クロロ-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7gのジクロロメタン50ml溶液に氷冷攪拌下、N,N-ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド0.54gを加え、室温で15分間攪拌した。次いで氷冷攪拌下、N-メチルピペラジン0.24ml及びトリエチルアミン0.46mlを加え、室温で終夜攪拌した。水を加え、ジクロロメタンで抽出し、水洗後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下に溶媒を留去して、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン:メタノール=40:1)にて精製して、7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-シクロヘキシルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7gを得た。

【0647】無色不定形

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm:

1.20-3.40 (22H, m), 2.21及び2.34 (3H, s), 3.50-3.90 (5H, m), 4.40-4.60及び5.05-5.20 (1H, m), 6.50-6.60 (1H, m), 6.85-6.95 (1H, m), 7.00-7.15 (3H, m), 7.25-7.50 (2H, m)。

【0648】適当な出発原料を用い、実施例4と同様にして下記実施例7、9、11~18、20~22、24、25、28~36、38~40、46~48、55~67、70~72、74~76、79、84、85、88、91~94、98、121~126、137及び138の化合物を得た。

【0649】実施例5

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)アセチル]ベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2.06gを塩化メチレン20ml-メタノール20mlの混合溶媒に溶解し、氷水浴上冷却攪拌下水素化ホウ素ナトリウム0.28gを添加した。氷水浴上冷却下2時間攪拌後溶媒の大部分を減圧下留去した。残渣に水を加え塩化メチレン抽出した。有機層を飽和食塩水洗、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:塩化メチレン:メタノール=20-10:1)で精製し、無色不定形として7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを2.08g得た。

【0650】¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.1-4.0, 4.35-4.65, 4.65-5.0及び5.0-5.25 (全27H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-7.6 (10H, m)。

【0651】適当な出発原料を用い、実施例5と同様にして下記実施例22、46及び94の化合物を得た。

【0652】実施例6

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-{4-[2-(2-メチルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]ベンゾイル}-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.5g、酢酸5ml及び無水酢酸3mlに濃硫酸1滴を加え室温で12時間、続いて60~70℃で6時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチル30mlを加え、このものに重曹を加えてアルカリ性にした。全体を酢酸エチルで抽出した後、有機相を飽和重曹水洗、飽和食塩水洗、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;塩化メチレン:メタノール=20:1)で精製し、無色不定形として7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)

ル) カルボニルメチル] -1- {4- [2- (2-メチルフェニル) -1-アセチルオキシエチル] ベンゾイル} -2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを0.36g得た。

【0653】¹H-NMR (200MHz, CDCl₃)
 δ ppm: 1.1-4.0, 4.35-4.7及び4.95-5.25 (全28H, m), 5.7-6.0 (1H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-

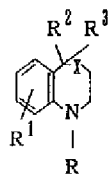
7.6 (10H, m)。

【0654】適当な出発原料を用いて、実施例6と同様にして下記実施例12及び48の化合物を得た。

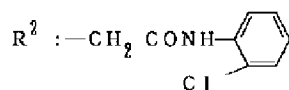
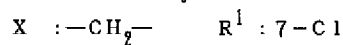
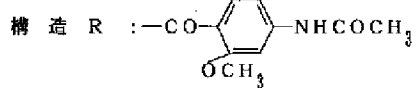
【0655】適当な出発原料を用い、実施例1及び2と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【0656】

【表58】



実施例 7



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

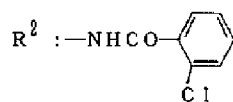
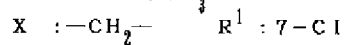
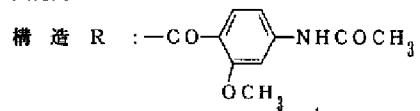
融 点 : 146-148℃

形 態 : 遊 離

【表59】

【0657】

実施例 8



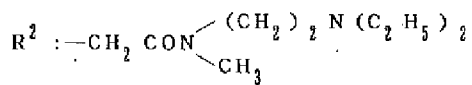
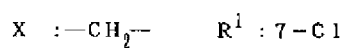
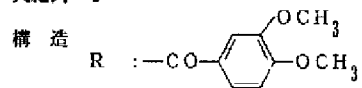
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 184-186℃

形 態 : 遊 離

実施例 9



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 1)

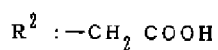
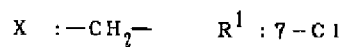
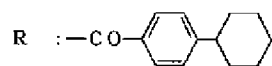
形 態 : 遊 離

【0658】

【表60】

実施例 10

構造



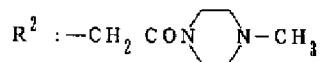
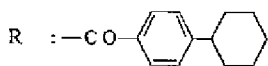
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 2)

形態 : 遊離

実施例 11

構造



結晶形 : 無色不定形

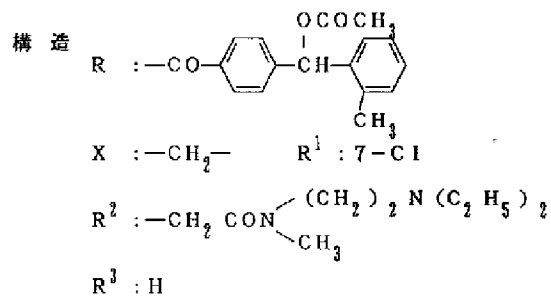
NMRスペクトル : 3)

形態 : 遊離

【0659】

【表61】

実施例 12

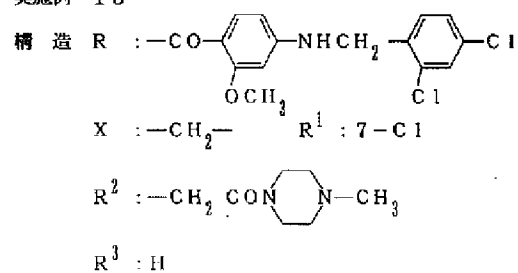


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 4)

形態 : 塩酸塩

実施例 13



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

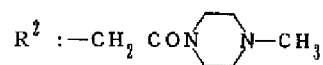
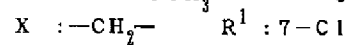
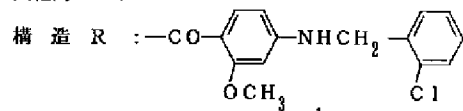
融点 : 186-187℃

形態 : 遊離

【0660】

【表62】

実施例 14



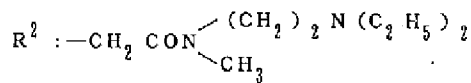
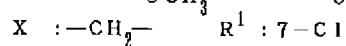
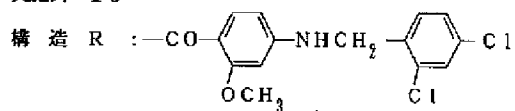
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 162-162.5℃

形態 : 遊離

実施例 15



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 5)

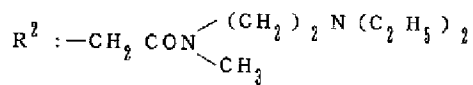
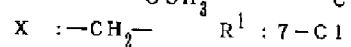
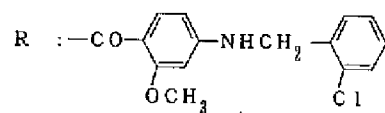
形態 : 遊離

【0661】

【表63】

実施例 16

構造



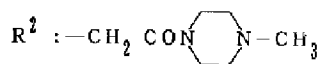
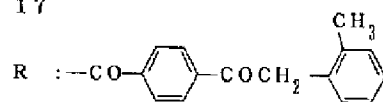
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 6)

形態 : 遊離

実施例 17

構造



結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール

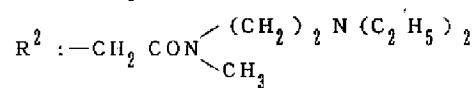
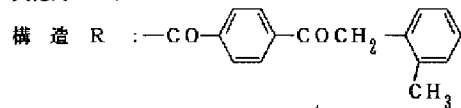
融点 : 181-182.5℃

形態 : 遊離

【0662】

【表6-4】

実施例 18



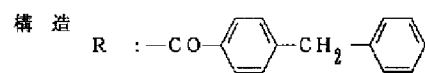
結 晶 形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 123-126℃

形 態 : 遊 離

実施例 19



結 晶 形 : 無色板状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 87.5-88℃

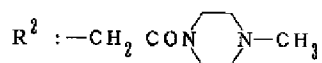
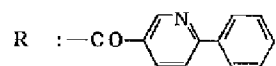
形 態 : 遊 離

【0663】

【表65】

実施例 20

構造



結晶形 : 白色粉末状

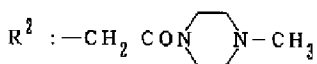
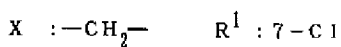
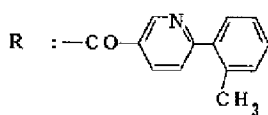
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 152-153℃

形態 : 遊離

実施例 21

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 7)

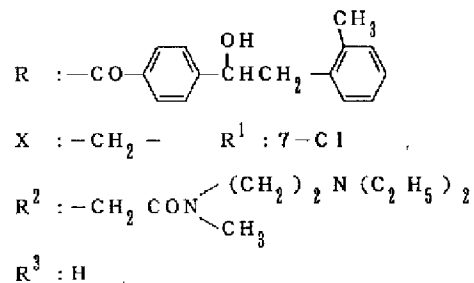
形態 : 遊離

【0664】

【表66】

実施例 22

構造



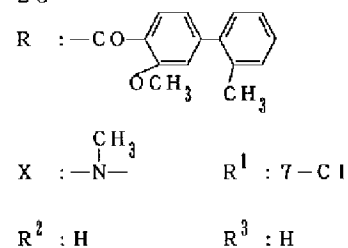
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 8)

形態 : 遊離

実施例 23

構造



結晶形 : 無色不定形

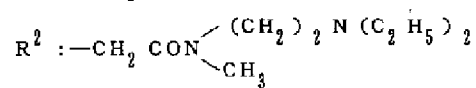
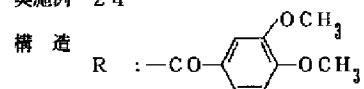
NMRスペクトル : 9)

形態 : 遊離

【0665】

【表67】

実施例 24

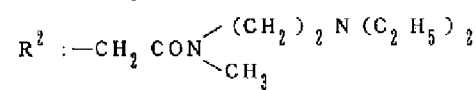
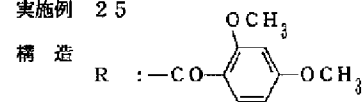


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 79)

形態 : 遊離

実施例 25



結晶形 : 淡黄色不定形

NMRスペクトル : 10)

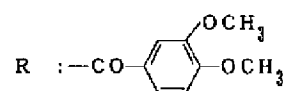
形態 : 塩酸塩

【0666】

【表68】

実施例 26

構 造



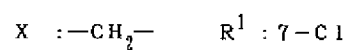
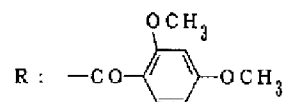
結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 11)

形 態 : 遊 離

実施例 27

構 造



結 晶 形 : 無色油状

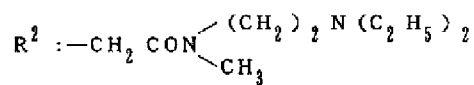
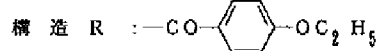
NMRスペクトル : 12)

形 態 : 遊 離

【0667】

【表69】

実施例 28

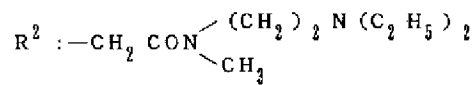
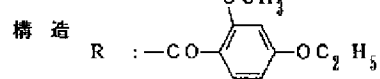


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 13)

形 態 : 塩酸塩

実施例 29



結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 14)

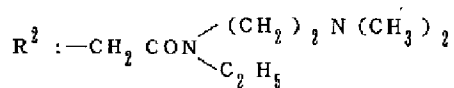
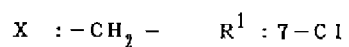
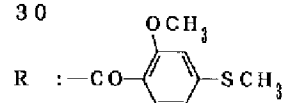
形 態 : 塩酸塩

【0668】

【表70】

実施例 30

構造



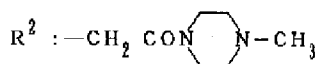
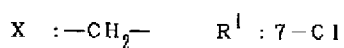
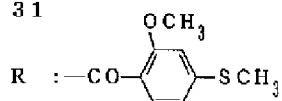
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 15)

形態 : 塩酸塩

実施例 31

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 16)

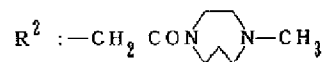
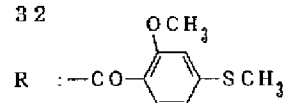
形態 : 塩酸塩

【0669】

【表71】

実施例 32

構造



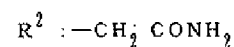
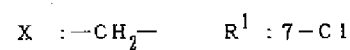
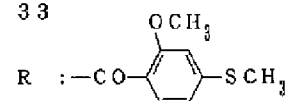
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 17)

形態 : 塩酸塩

実施例 33

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

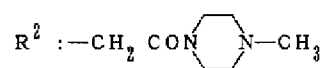
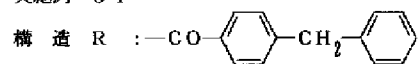
融点 : 104-108℃

形態 : 遊離

【0670】

【表72】

実施例 34

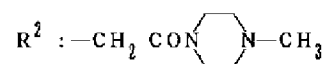
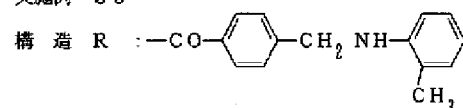


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 18)

形 態 : 遊 離

実施例 35



結 晶 形 : 無色不定形

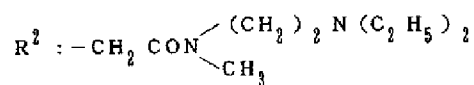
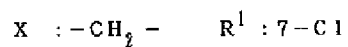
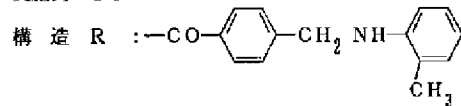
NMRスペクトル : 19)

形 態 : 遊 離

【0671】

【表73】

実施例 36

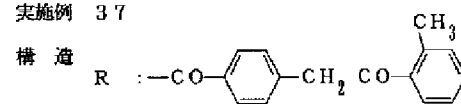


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 20)

形 態 : 遊 離

実施例 37



結 晶 形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

融 点 : 145-147℃

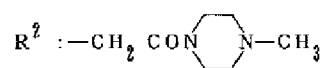
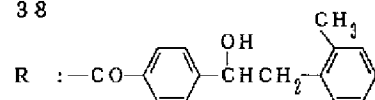
形 態 : 遊 離

【0672】

【表74】

実施例 38

構造



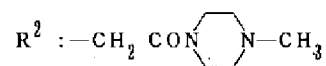
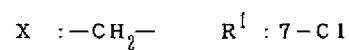
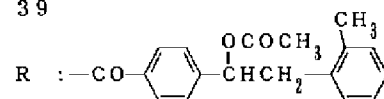
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 21)

形態 : 遊離

実施例 39

構造



結晶形 : 無色不定形

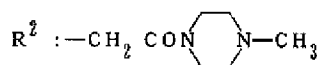
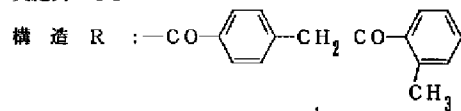
NMRスペクトル : 22)

形態 : 遊離

【0673】

【表75】

実施例 40

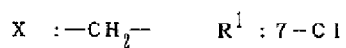
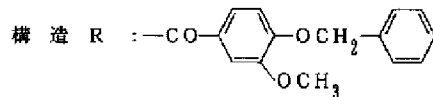


結 晶 形 : 淡黄色粘稠油

NMRスペクトル : 23)

形 態 : 遊 離

実施例 41



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

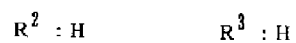
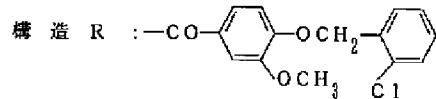
融 点 : 133-133.5℃

形 態 : 遊 離

【0674】

【表76】

実施例 42



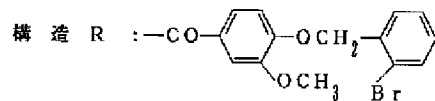
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 135℃

形 態 : 遊 離

実施例 43



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

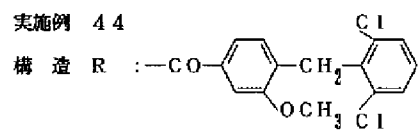
融 点 : 133℃

形 態 : 遊 離

【0675】

【表77】

実施例 44



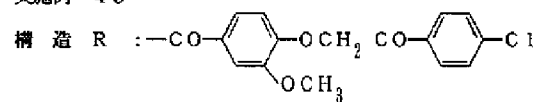
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融点 : 154℃

形態 : 遊離

実施例 45



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

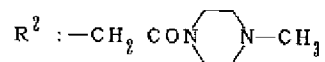
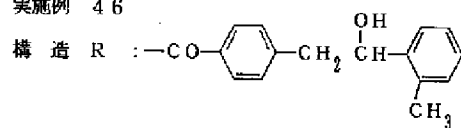
融点 : 166℃

形態 : 遊離

【0676】

【表78】

実施例 46

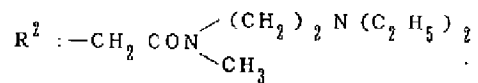
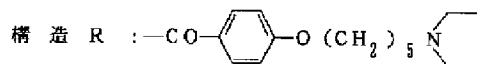


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 24)

形態 : 遊離

実施例 47



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 25)

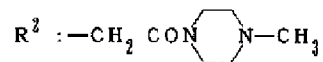
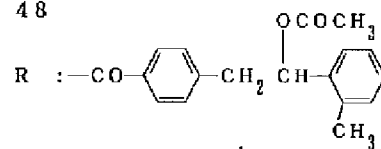
形態 : 2塩酸塩

【0677】

【表79】

実施例 48

構造



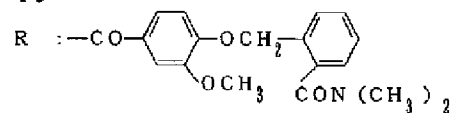
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 26)

形態 : 遊離

実施例 49

構造



結晶形 : 無色不定形

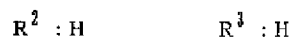
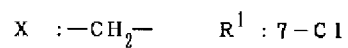
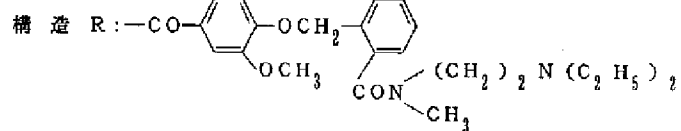
NMRスペクトル : 27)

形態 : 遊離

【0678】

【表80】

実施例 50

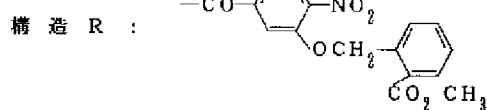


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 28)

形 態 : 塩酸塩

実施例 51



結 晶 形 : 黄色板状晶

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 125℃

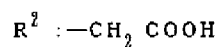
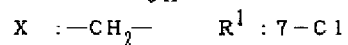
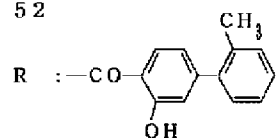
形 態 : 遊 離

【0679】

【表81】

実施例 52

構造



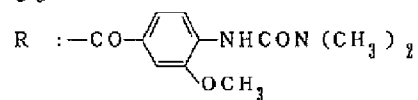
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 80)

形態 : 遊離

実施例 53

構造



結晶形 : 白色板状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

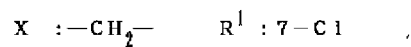
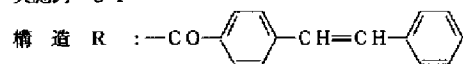
融点 : 230-232℃

形態 : 遊離

【0680】

【表82】

実施例 54

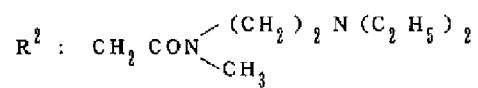
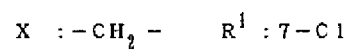
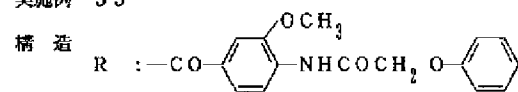


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 81)

形態 : 遊離

実施例 55



結晶形 : 無色不定形

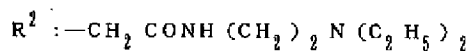
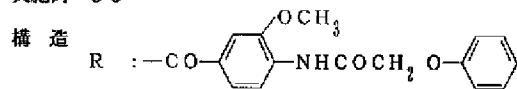
NMRスペクトル : 82)

形態 : 塩酸塩

【0681】

【表83】

実施例 56

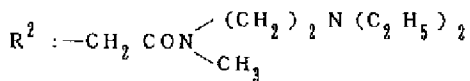
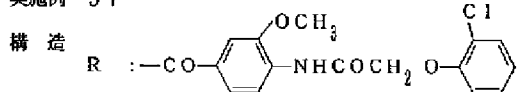


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 83)

形態 : 塩酸塩

実施例 57



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 84)

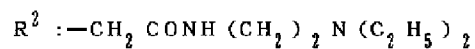
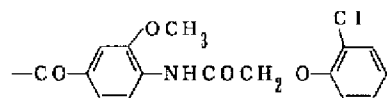
形態 : 塩酸塩

【0682】

【表84】

実施例 58

構造



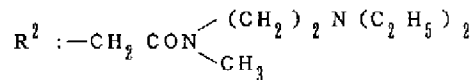
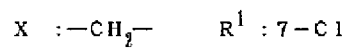
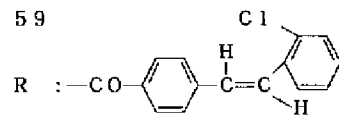
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 85)

形態 : 塩酸塩

実施例 59

構造



結晶形 : 無色粘稠油

NMRスペクトル : 29)

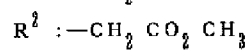
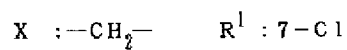
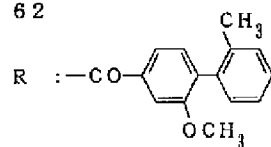
形態 : 遊離

【0683】

【表85】

実施例 62

構造



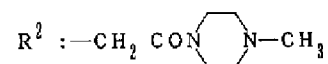
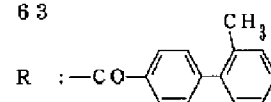
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 32)

形態 : 遊離

実施例 63

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 33)

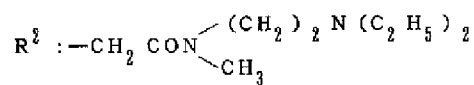
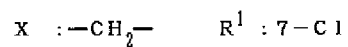
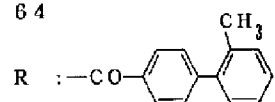
形態 : 遊離

【0685】

【表87】

実施例 64

構造



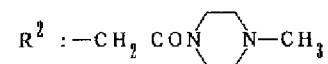
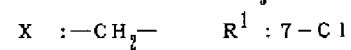
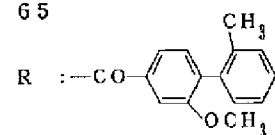
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 34)

形態 : 遊離

実施例 65

構造



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 35)

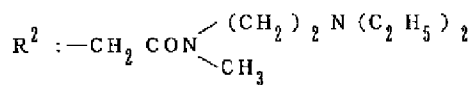
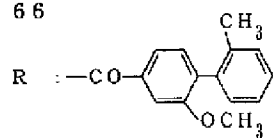
形態 : HCl

【0686】

【表88】

実施例 66

構造



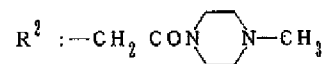
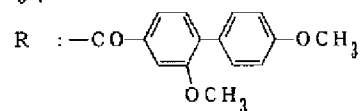
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 36)

形態 : HCl

実施例 67

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

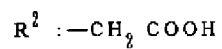
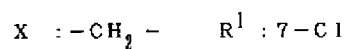
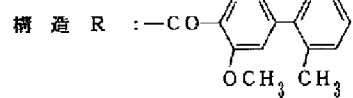
融点 : 174-176°C

形態 : 遊離

【0687】

【表89】

実施例 68



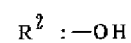
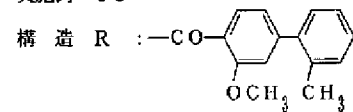
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 203-204℃

形態 : 遊離

実施例 69



結晶形 : 無色不定形

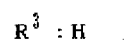
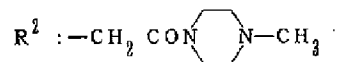
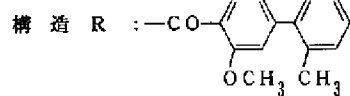
NMRスペクトル : 37)

形態 : 遊離

【0688】

【表90】

実施例 70



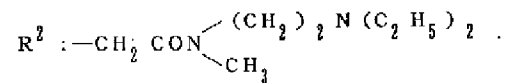
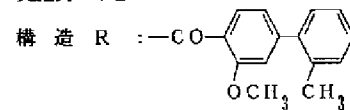
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融 点 : 181-182℃

形 態 : 遊 離

実施例 71



結 晶 形 : 無色不定形

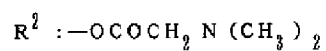
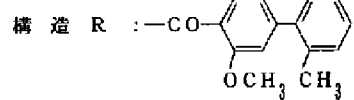
NMRスペクトル : 38)

形 態 : HCl

【0689】

【表91】

実施例 72



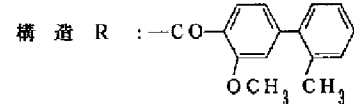
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 153-155℃

形 態 : HCl

実施例 73



結 晶 形 : 無色不定形

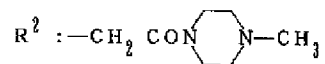
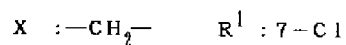
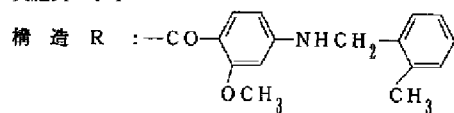
NMRスペクトル : 3.9)

形 態 : 遊 離

【0690】

【表92】

実施例 74



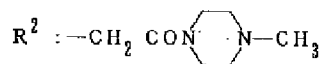
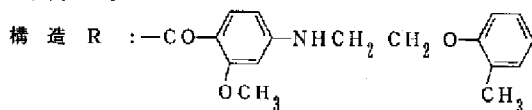
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 153-154.5℃

形 態 : 遊 離

実施例 75



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

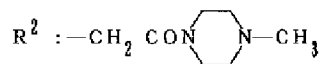
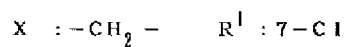
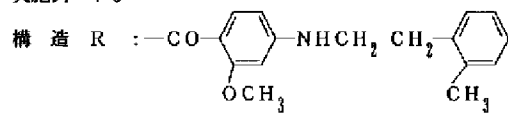
融 点 : 160-161℃

形 態 : 遊 離

【0691】

【表93】

実施例 76



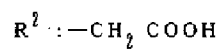
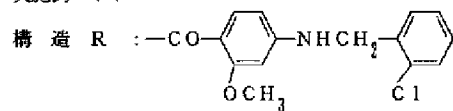
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

融 点 : 135-136℃

形 態 : 遊 離

実施例 77



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

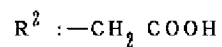
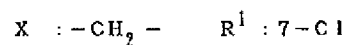
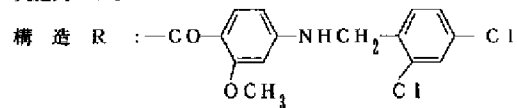
融 点 : 134-136.5℃

形 態 : 遊 離

【0692】

【表94】

実施例 78



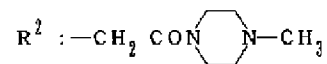
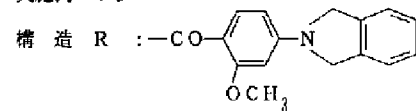
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 140.5-142℃

形 態 : 遊 離

実施例 79



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 199.5-202℃

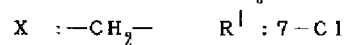
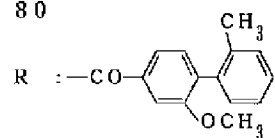
形 態 : 遊 離

【0693】

【表95】

実施例 80

構 造



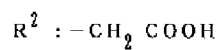
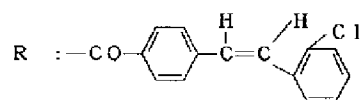
結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 40)

形 態 : 遊 離

実施例 81

構 造



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 187-190℃

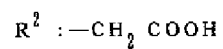
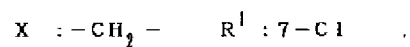
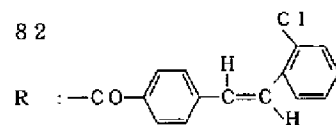
形 態 : 遊 離

【0694】

【表96】

実施例 82

構造



結晶形 : 白色粉末状

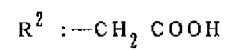
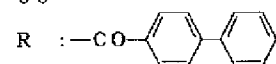
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

融点 : 189-192℃

形態 : 遊離

実施例 83

構造



結晶形 : 白色粉末状

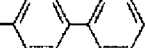
融点 : 205-207℃

形態 : 遊離


【0695】

【表97】

実施例 84

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2-\text{CON}-\text{N}-\text{CH}_3$


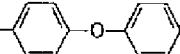
R³ : H

結 晶 形 : 無色不定形


NMRスペクトル : 41)

形 態 : 遊 離

実施例 85

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2-\text{CON}-\text{N}-\text{CH}_3$


R³ : H

結 晶 形 : 無色不定形

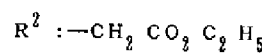
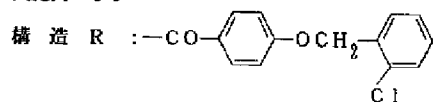
NMRスペクトル : 42)

形 態 : 遊 離

【0696】

【表98】

実施例 86

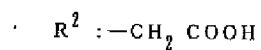
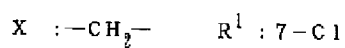
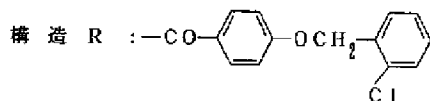


結 晶 形 : 無色油状

NMRスペクトル : 43)

形 態 : 遊 離

実施例 87



結 晶 形 : 無色油状

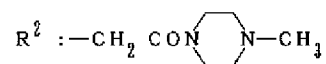
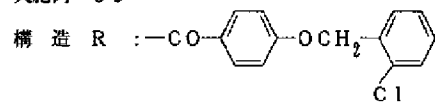
NMRスペクトル : 44)

形 態 : 遊 離

【0697】

【表99】

実施例 88

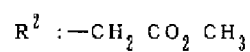
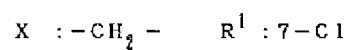
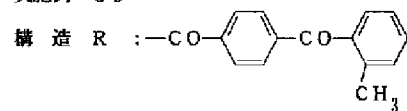


結 晶 形 : 無色油状

NMRスペクトル : 45)

形 態 : 遊 離

実施例 89



結 晶 形 : 無色油状

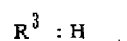
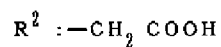
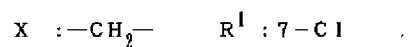
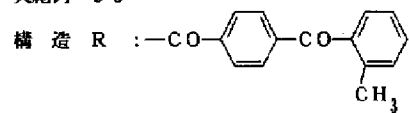
NMRスペクトル : 46)

形 態 : 遊 離

【0698】

【表100】

実施例 90

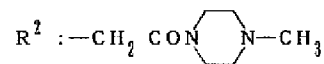
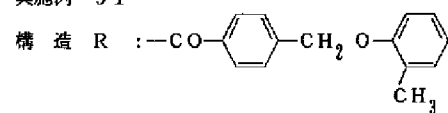


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 47)

形態 : 遊離

実施例 91



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 84-88℃

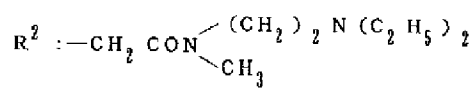
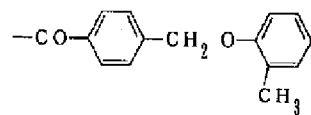
形態 : 遊離

【0699】

【表101】

実施例 92

構造



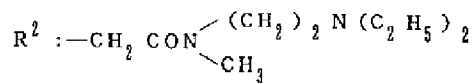
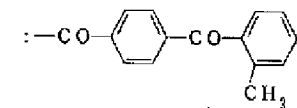
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 48)

形態 : 遊離

実施例 93

構造 R :



結晶形 : 無色不定形

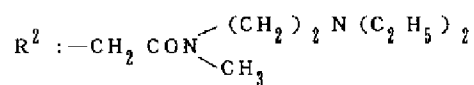
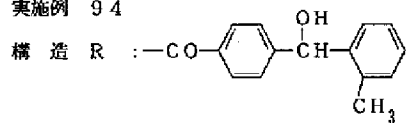
NMRスペクトル : 49)

形態 : 遊離

【0700】

【表102】

実施例 94

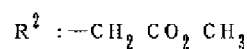
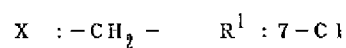
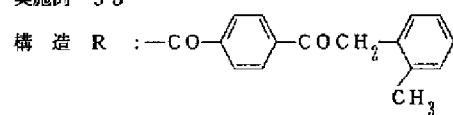


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 50)

形 態 : 遊 離

実施例 95



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

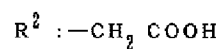
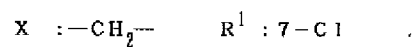
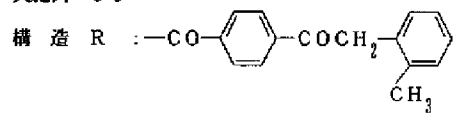
融 点 : 120-122℃

形 態 : 遊 離

【0701】

【表103】

実施例 96

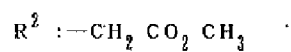
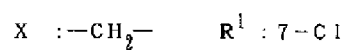
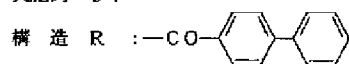


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 51)

形 態 : 遊 離

実施例 97



結 晶 形 : 無色油状

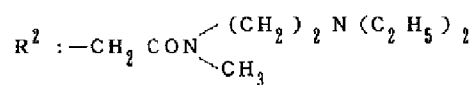
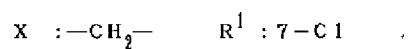
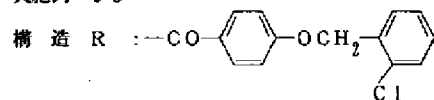
NMRスペクトル : 52)

形 態 : 遊 離

【0702】

【表104】

実施例 98

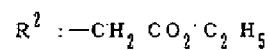
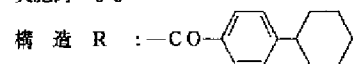


結晶形 : 無色油状

NMRスペクトル : 53)

形態 : 遊離

実施例 99



結晶形 : 無色油状

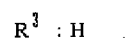
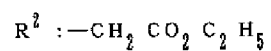
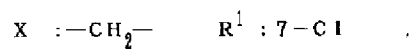
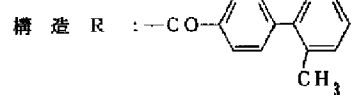
NMRスペクトル : 54)

形態 : 遊離

【0703】

【表105】

実施例 100

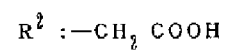
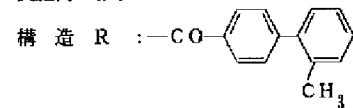


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 55)

形態 : 遊離

実施例 101



結晶形 : 無色不定形

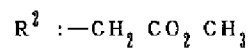
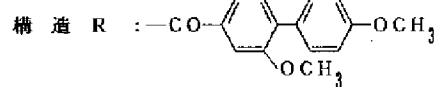
NMRスペクトル : 56)

形態 : 遊離

【0704】

【表106】

実施例 102

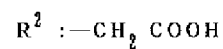
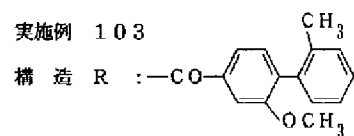


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 57)

形 態 : 遊 離

実施例 103



結 晶 形 : 無色不定形

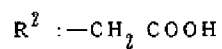
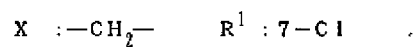
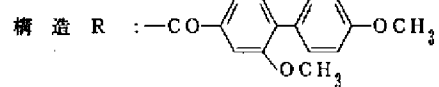
NMRスペクトル : 58)

形 態 : 遊 離

【0705】

【表107】

実施例 104

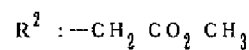
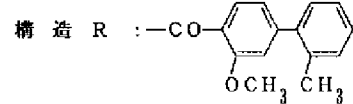


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 59)

形 態 : 遊 離

実施例 105



結 晶 形 : 無色不定形

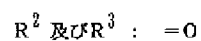
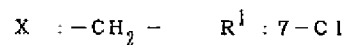
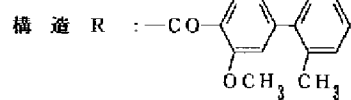
NMRスペクトル : 60)

形 態 : 遊 離

【0706】

【表108】

実施例 106



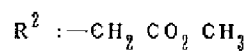
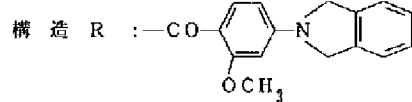
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

NMRスペクトル : 61)

形 態 : 遊 離

実施例 107



結 晶 形 : 無色不定形

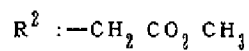
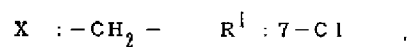
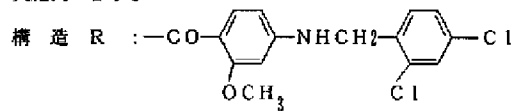
NMRスペクトル : 62)

形 態 : 遊 離

【0707】

【表109】

実施例 108

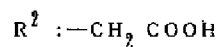
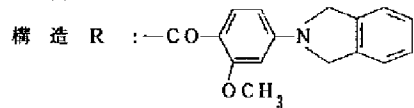


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 63)

形 態 : 遊 離

実施例 109



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

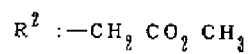
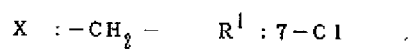
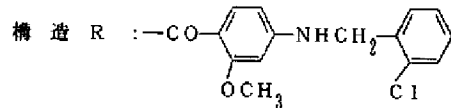
融 点 : 169-171℃

形 態 : 遊 離

【0708】

【表110】

実施例 110

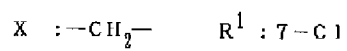
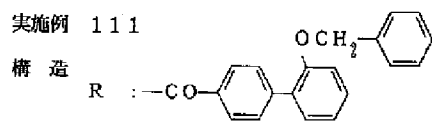


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 64)

形態 : 遊離

実施例 111



結晶形 : 無色不定形

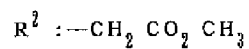
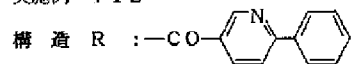
NMRスペクトル : 65)

形態 : 遊離

【0709】

【表111】

実施例 112



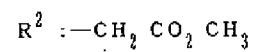
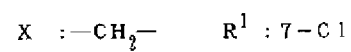
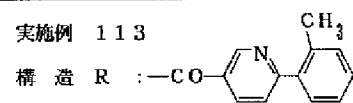
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 139.5-142℃

形態 : 遊離

実施例 113



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 6.6)

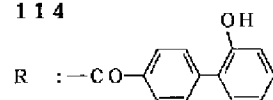
形態 : 遊離

【0710】

【表112】

実施例 114

構造



結晶形 : 白色粉末状

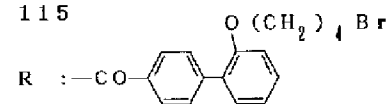
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 226℃

形態 : 遊離

実施例 115

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

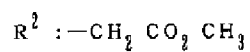
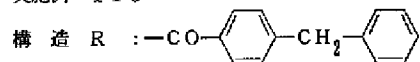
融点 : 142-142.5℃

形態 : 遊離

【0711】

【表113】

実施例 116

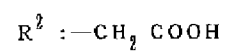
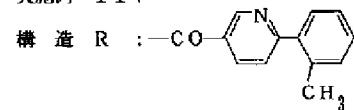


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 67)

形 態 : 遊 離

実施例 117



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

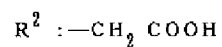
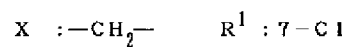
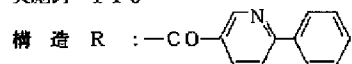
融 点 : 235-237℃ (分解)

形 態 : 遊 離

【0712】

【表114】

実施例 118



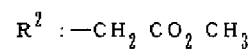
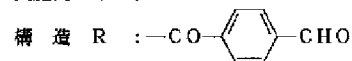
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融 点 : 183℃

形 態 : 遊 離

実施例 119



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン


NMRスペクトル : 6.8)

形 態 : 遊 離

【0713】

【表115】

実施例 120

構造 R :  -CHO

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2 \text{COOH}$

$\text{R}^3 : \text{H}$


結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融 点 : 192℃

形 態 : 遊 離

実施例 121

構造 R :  -CHO

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2 \text{CON} \langle \text{piperidine ring} \rangle \text{N}-\text{CH}_3$

$\text{R}^3 : \text{H}$

結 晶 形 : 無色不定形


NMRスペクトル : 69)

形 態 : 遊 離

【0714】

【表116】

実施例 122

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2 \text{ CON} \begin{array}{l} \text{---} (\text{CH}_2)_2 \text{N} (\text{C}_2\text{H}_5)_2 \\ \text{---} \text{CH}_3 \end{array}$

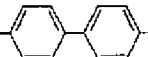
$\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 70)

形態 : 遊離

実施例 123

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2 \text{ CON} \begin{array}{c} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{10} \text{---} \\ \text{---} \text{N}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$

$\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 71)

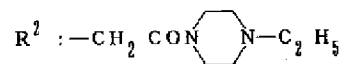
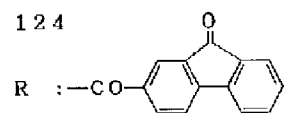
形態 : HCl

【0715】

【表117】

実施例 124

構造



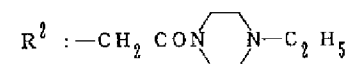
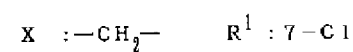
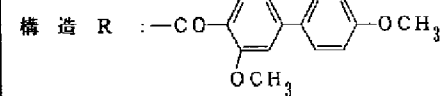
結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 182-184°C

形態 : HCl

実施例 125



結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 72)

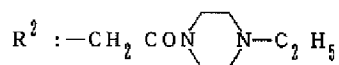
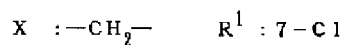
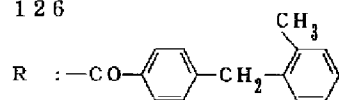
形態 : HCl

【0716】

【表118】

実施例 126

構造



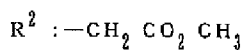
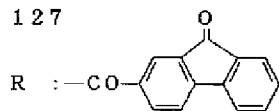
結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 7.3)

形態 : HCl

実施例 127

構造



結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル


融点 : 168℃

形態 : 遊離

【0717】

【表119】

実施例 128

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

$\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : $186-188^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 129

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ $\text{R}^1 : 7-\text{Cl}$

$\text{R}^2 : -\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

$\text{R}^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

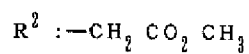
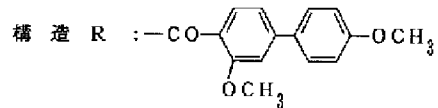
融点 : 120°C

形態 : 遊離

【0718】

【表120】

実施例 130

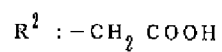
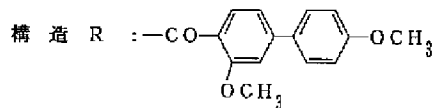


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 74)

形態 : 遊離

実施例 131



結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

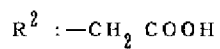
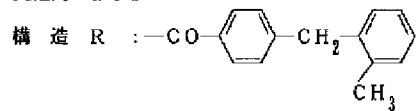
融点 : 109-111℃

形態 : 遊離

【0719】

【表121】

実施例 132

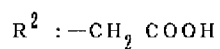
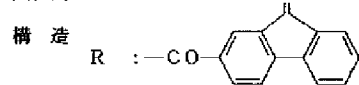


結 晶 形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 7.5)

形 態 : 遊 離

実施例 133



結 晶 形 : 黄色針状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

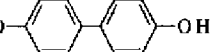
融 点 : 202-203℃

形 態 : 遊 離

【0720】

【表122】

実施例 134

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

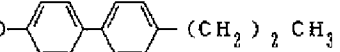
結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン

融点 : 235℃

形態 : 遊離

実施例 135

構造 R : 

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

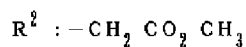
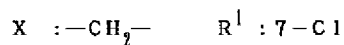
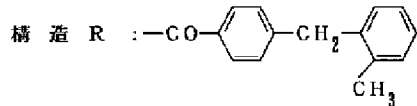
融点 : 176℃

形態 : 遊離

【0721】

【表123】

実施例 136

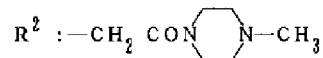
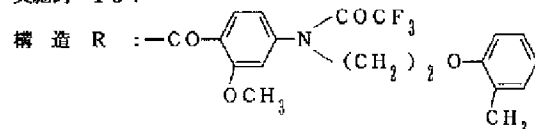


結晶形 : 無色不定形

NMRスペクトル : 76)

形態 : 遊離

実施例 137



結晶形 : 無色不定形

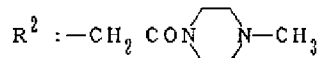
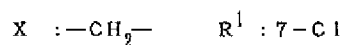
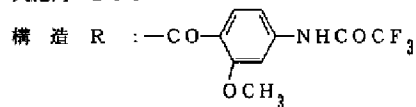
NMRスペクトル : 77)

形態 : 遊離

【0722】

【表124】

実施例 138



結晶形 : 白色粉末状

NMRスペクトル : 78)

形態 : 遊離

【0723】NMR 1) (実施例9)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm :
0.78-5.25 (23H, m), 2.96及び3.

20 (全3H, s), 3.71 (3H, s), 3.83
(3H, s), 6.51-7.18 (6H, m)。

【0724】NMR 2) (実施例10)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 20-2. 25 (14H, m), 2. 30-2. 55 (1H, m), 2. 60-3. 30 (3H, m), 3. 50-3. 90 (1H, m), 4. 45-4. 60 及び 5. 10-5. 30 (1H, m), 6. 15 (1H, brs), 6. 59 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6. 85-7. 00 (3H, m), 7. 10-7. 35 (3H, m)。

【0725】NMR 3) (実施例11)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 20-3. 40 (22H, m), 2. 21 及び 2. 34 (3H, s), 3. 50-3. 90 (5H, m), 4. 40-4. 60 及び 5. 05-5. 20 (1H, m), 6. 50-6. 60 (1H, m), 6. 85-6. 95 (1H, m), 7. 00-7. 15 (3H, m), 7. 25-7. 50 (2H, m)。

【0726】NMR 4) (実施例12)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 82, 1. 02 及び 1. 08 (全6H, 各t, $J=7\text{Hz}$), 1. 2-4. 0, 4. 35-4. 65 及び 4. 95-5. 24 (全27H, m), 6. 35-6. 70 (1H, m), 6. 75-7. 65 (10H, m)。

【0727】NMR 5) (実施例15)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 71-2. 24 (11H, m), 2. 25-5. 17 (21H, m), 5. 71-7. 54 (9H, m)。

【0728】NMR 6) (実施例16)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 78-5. 16 (32H, m), 5. 79-7. 51 (10H, m)。

【0729】NMR 7) (実施例21)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 00-5. 26 (17H, m), 2. 28 及び 2. 34 (各3H, 各s), 6. 54-6. 75 (1H, m), 6. 89-7. 93 (8H, m), 8. 48-8. 74 (1H, m)。

【0730】NMR 8) (実施例22)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 85, 1. 00 及び 1. 07 (全6H, 各t, $J=7\text{Hz}$), 1. 1-4. 0, 4. 35-4. 65, 4. 65-4. 95 及び 4. 95-5. 25 (全27H, m), 6. 4-6. 65 (1H, m), 6. 75-7. 65 (10H, m)。

【0731】NMR 9) (実施例23)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2. 15 (3H, s), 2. 40 (3H, s), 2. 71-4. 00 (7H, m), 4. 01-4. 39 (1H, m), 4. 69-5. 01 (1H, m), 6. 42-7. 55 (10H, m)。

【0732】NMR 10) (実施例25)

^1H -NMR (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1. 03-2. 08 (4H, m), 1. 22 (6H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2. 62-4. 95 (22H, m), 6. 23-7. 42 (6H, m), 10. 45-11. 47 (1H, m)。

【0733】NMR 11) (実施例26)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 34-1. 72 (1H, m), 1. 81-2. 25 (3H, m), 2. 57-3. 18 (3H, m), 3. 70 (3H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 35-5. 22 (1H, m), 6. 53-6. 69 (2H, m), 6. 73 (1H, dd, $J=8.4\text{Hz}$, 1. 8Hz), 6. 82 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 6. 91 (1H, dd, $J=8.4\text{Hz}$, 2. 4Hz), 7. 24 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$)。

【0734】NMR 12) (実施例27)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 32-2. 14 (4H, m), 2. 57-3. 20 (3H, m), 3. 52 (3H, s), 3. 73 (3H, s), 4. 82-5. 05 (1H, m), 6. 16 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 6. 35 (1H, dd, $J=8.4\text{Hz}$, 2. 2Hz), 6. 64 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 6. 81 (1H, dd, $J=8.4\text{Hz}$, 2. 4Hz), 7. 06-7. 24 (2H, m)。

【0735】NMR 13) (実施例28)

^1H -NMR (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
0. 78-2. 13 (13H, m), 2. 65-5. 12 (13H, m), 3. 17 及び 3. 33 (全3H, s), 3. 95 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 6. 55-7. 58 (7H, m), 10. 53-11. 48 (1H, m)。

【0736】NMR 14) (実施例29)

^1H -NMR (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
0. 98-2. 06 (13H, m), 2. 61-4. 88 (21H, m), 6. 18-7. 45 (6H, m), 10. 42-11. 52 (1H, m)。

【0737】NMR 15) (実施例30)

^1H -NMR (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
0. 92-1. 95 (7H, m), 2. 34-4. 43 (14H, m), 2. 41 及び 2. 53 (全3H, s), 2. 77 (6H, s), 6. 52-7. 38 (6H, m), 10. 58-11. 57 (2H, m)。

【0738】NMR 16) (実施例31)

^1H -NMR (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
0. 96-2. 03 (4H, m), 2. 33-4. 62 (13H, m), 2. 41 及び 2. 53 (全3H, s), 2. 76 (3H, s), 3. 34 (3H, s), 6. 52-7. 48 (6H, m), 11. 48 (1H, m)。

b r s)。

【0739】NMR 17) (実施例32)

^1H -NMR (200MHz, DMSO- d_6) δ p p m: 0.96-4.87 (22H, m), 2.40及び2.53 (全3H, s), 2.73及び2.77 (全3H, s), 6.51-7.45 (6H, m), 11.36 (1H, b r s)。

【0740】NMR 18) (実施例34)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.17-5.24 (22H, m), 6.41-7.58 (12H, m)。

【0741】NMR 19) (実施例35)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.10-5.24 (26H, m), 6.32-7.69 (11H, m)。

【0742】NMR 20) (実施例36)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 0.74-5.24 (32H, m), 6.28-7.70 (11H, m)。

【0743】NMR 21) (実施例38)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.1-4.0, 4.35-4.65, 4.65-5.0及び5.0-5.25 (全27H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-7.6 (10H, m)。

【0744】NMR 22) (実施例39)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.1-4.0, 4.35-4.7及び4.95-5.25 (全28H, m), 5.7-6.0 (1H, m), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-7.6 (10H, m)。

【0745】NMR 23) (実施例40)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.2-4.65及び4.95-5.25 (全25H, m), 6.35-6.65及び6.65-8.2 (全11H, m)。

【0746】NMR 24) (実施例46)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.2-3.95, 4.45-4.65, 4.7-4.9及び5.0-5.25 (全27H, m), 6.4-6.65及び6.75-7.6 (全11H, m)。

【0747】NMR 25) (実施例47)

^1H -NMR (200MHz, DMSO- d_6) δ p p m: 1.12-2.06 (20H, m), 2.66-4.40 (21H, m), 3.18及び3.33 (全3H, s), 6.53-7.41 (7H, m), 10.67-11.53 (2H, m)。

【0748】NMR 26) (実施例48)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.1-3.95, 4.45-4.65及び4.95-

5.25 (全29H, m), 5.7-6.05 (1H, m), 6.35-6.65 (1H, m), 6.75-7.65 (9H, m)。

【0749】NMR 27) (実施例49)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.22-2.34 (4H, m), 2.42-3.42 (3H, m), 2.82 (3H, s), 3.01 (3H, s), 3.68 (3H, s), 4.81-5.41 (1H, m), 5.08 (2H, s), 6.42-7.12 (5H, m), 7.13-7.72 (5H, m)。

【0750】NMR 28) (実施例50)

^1H -NMR (200MHz, DMSO- d_6) δ p p m: 0.90-2.25 (4H, m), 1.17 (6H, t, $J=7.10\text{Hz}$), 2.40-3.90 (17H, m), 4.63-5.17 (1H, m), 4.98 (2H, s), 6.52-7.21 (5H, m), 7.24-7.65 (5H, m), 10.16-10.70 (1H, m)。

【0751】NMR 29) (実施例59)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 0.8-1.2 (6H, m), 1.2-4.0, 4.4-4.65及び5.0-5.25 (20H, m), 6.45-6.65 (1H, m), 6.6-7.75 (12H, m)。

【0752】NMR 30) (実施例60)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 0.8-1.15 (6H, m), 1.15-3.95, 4.35-4.65及び4.95-5.25 (全20H, m), 2.96, 3.17 (各s), 6.4-7.6 (13H, m)。

【0753】NMR 31) (実施例61)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.06-2.41 (7H, m), 2.31 (3H, s), 2.51-4.38 (16H, m), 4.51-4.92 (2H, m), 6.53-7.52 (10H, m), 12.52-12.94 (1H, m)。

【0754】NMR 32) (実施例62)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.13-2.26 (5H, m), 2.02 (3H, s), 2.58-5.29 (7H, m), 3.69 (3H, s), 6.49-7.45 (10H, m)。

【0755】NMR 33) (実施例63)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 1.15-5.29 (17H, m), 2.16 (3H, s), 2.34 (3H, s), 6.47-7.62 (11H, m)。

【0756】NMR 34) (実施例64)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ p p m: 0.70-1.19 (6H, m), 1.20-5.25 (20H, m), 2.16 (3H, m), 6.48-

7. 62 (1H, m)。

【0757】NMR 35) (実施例65)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 02-5. 28 (23H, m), 2. 02 (3H, s), 6. 52-7. 50 (10H, m), 11. 68-12. 41 (1H, m)。

【0758】NMR 36) (実施例66)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 04-5. 32 (29H, m), 2. 02 (3H, s), 6. 48-7. 51 (10H, m), 11. 87-12. 28 (1H, m)。

NMR 37) (実施例69)
 ^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 46-2. 41 (4H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 68-2. 98 (1H, m), 3. 27-3. 83 (4H, m), 4. 68-5. 27 (2H, m), 6. 47-7. 54 (9H, m), 7. 60 (1H, d, $J=2.16\text{Hz}$)。

【0759】NMR 38) (実施例71)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 86-5. 20 (32H, m), 6. 51-7. 52 (10H, m), 11. 62-12. 24 (1H, m)。

【0760】NMR 39) (実施例73)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 28-2. 28 (4H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 58-2. 92 (2H, m), 2. 93-3. 28 (1H, m), 3. 58 (3H, s), 4. 82-5. 12 (1H, m), 6. 56 (1H, s), 6. 65-6. 96 (3H, m), 6. 97-7. 48 (6H, m)。

【0761】NMR 40) (実施例80)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 21-2. 25 (4H, m), 2. 01 (3H, s), 2. 26-3. 20 (3H, m), 3. 59 (3H, s), 4. 86-5. 22 (1H, m), 6. 42-7. 45 (10H, m)。

【0762】NMR 41) (実施例84)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-4. 0, 4. 35-4. 65及び5. 0-5. 25 (全20H, m, 2. 34 (s)), 6. 45-6. 7 (1H, m), 6. 91 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, 8Hz), 7. 05 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7. 15-7. 7 (9H, m)。

【0763】NMR 42) (実施例85)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 2-3. 95, 4. 35-4. 65, 5. 0-5. 25 (全20H, m, 2. 33 (s)), 6. 4-7. 55 [12H, m, 6. 59 (d, $J=8\text{Hz}$), 6. 79 (d, $J=8.5\text{Hz}$)]。

【0764】NMR 43) (実施例86)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-2. 2 (7H, m), 2. 45-3. 3, 3. 35-3. 9, 4. 0-4. 35, 4. 35-4. 65及び4. 95-5. 35 (全9H, m, 5. 09 (s)), 6. 45-6. 65 (1H, m), 6. 77 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6. 92 (1H, d, $J=2\text{Hz}$, 8. 5Hz), 7. 05-7. 6 (7H, m)。

【0765】NMR 44) (実施例87)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 2 (4H, m), 2. 5-3. 3, 3. 35-3. 9, 4. 3-4. 6及び4. 9-5. 3 (全7H, m, 5. 06 (s)), 4. 45-6. 65 (1H, m), 6. 74 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6. 93 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, 8. 5Hz), 7. 12 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7. 12-7. 55 (6H, m)。

【0766】NMR 45) (実施例88)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 85, 2. 85-4. 0, 4. 35-4. 65及び4. 9-5. 35 (全22H, 2. 33, 5. 10 (各s)), 6. 4-6. 65 (1H, m), 6. 80 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6. 92 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, 8. 5Hz), 7. 04 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7. 04-7. 6 (6H, m)。

【0767】NMR 46) (実施例89)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 20-2. 45 (7H, m, 2. 27 (s)), 2. 5-3. 1, 3. 1-3. 4, 3. 4-3. 9, 4. 35-4. 65及び5. 02-5. 30 (全8H, m, 3. 72 (s)), 6. 56 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6. 92 (1H, dd, $J=2.3\text{Hz}$, 8. 4Hz), 7. 10 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7. 10-7. 71 (8H, m)。

【0768】NMR 47) (実施例90)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 23-2. 47 (4H, m), 2. 26 (3H, s), 2. 6-3. 05 (2H, m), 3. 10-3. 43, 3. 48-3. 90, 4. 35-4. 62及び5. 05-5. 29 (全3H, m), 6. 56 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6. 90 (1H, dd, $J=2.2\text{Hz}$, 8. 3Hz), 7. 08 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7. 12-7. 55 (6H, m), 7. 61 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$)。

【0769】NMR 48) (実施例92)

^1H -NMR (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 84, 1. 05及び1. 08 (全6H, 各t, $J=7\text{Hz}$), 1. 2-4. 0, 4. 1-4. 7及び4. 8

-5.3 (全25H, m, 2.24 (s)), 2.61 (q, J=7Hz), 2.99, 3.19 (各s), 6.4-7.7 (11H, m, 6.55 (d, J=8Hz))。

【0770】NMR 49) (実施例93)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.90, 0.97及び1.07 (全6H, 各t, J=7Hz), 1.15-4.02, 4.38-4.65及び4.95-5.25 (全23H, m, 2.26, 3.18 (各s)), 6.54 (1H, d, J=8.3Hz), 6.77-7.70 (10H, m)。

【0771】NMR 50) (実施例94)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.82, 1.00及び1.07 (全6H, 各t, J=7Hz), 1.15-3.98, 4.47-4.68, 4.95-5.22及び5.75-6.10 (全25H, m), 6.40-6.68及び6.73-7.68 (全11H, m)。

【0772】NMR 51) (実施例96)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.2-2.4 (4H, m), 2.20 (3H, s), 2.5-3.35, 3.4-3.9, 4.25-4.6及び4.9-6.2 (全8H, m, 4.22 (s)), 6.4-6.65 (1H, m), 6.75-6.95 (1H, m), 6.95-7.35 (5H, m), 7.42 (2H, d, J=8.5Hz), 7.81 (2H, d, J=8.5Hz)。

【0773】NMR 52) (実施例97)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.2-2.3, 2.5-3.4, 3.5-4.3, 4.35-4.7及び5.05-5.35 (全12H, 3.75 (s)), 6.4-6.7 (1H, m), 6.93 (1H, dd, J=2Hz, 8.5Hz), 7.13 (1H, d, J=2Hz), 7.2-7.8 (9H, m)。

【0774】NMR 53) (実施例98)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.85, 1.03及び1.08 (全6H, 各t, J=7Hz), 1.2-4.0, 4.3-4.65及び4.9-5.3 (全22H, 2.99, 3.19, 5.10 (各s)), 6.45-7.6 (11H, m)。

【0775】NMR 54) (実施例99)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.27 (3H, t, J=7.1Hz), 1.20-2.20 (14H, m), 2.30-2.50 (1H, m), 2.60-3.05 (3H, m), 3.10-3.35 (1H, m), 4.10-4.40 (2H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 6.57 (1H, d, J=8.4Hz), 6.96 (1H, d, J=8.1Hz), 7.00 (2H, d, J=8.0Hz)

z), 7.10-7.35 (3H, m)。

【0776】NMR 55) (実施例100)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.08-2.41 (5H, m), 1.25 (3H, t, J=7.10Hz), 2.16 (3H, s), 2.54-5.32 (6H, m), 6.48-7.54 (11H, m)。

【0777】NMR 56) (実施例101)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.14-2.36 (5H, m), 2.26 (3H, s), 2.51-5.35 (4H, m), 6.45-7.50 (11H, m), 8.65-13.90 (1H, m)。

【0778】NMR 57) (実施例102)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.18-2.39 (5H, m), 2.57-3.05 (2H, m), 3.09-5.28 (2H, m), 3.67, 3.72及び3.82 (各3H, 各s), 6.48-7.81 (10H, m)。

【0779】NMR 58) (実施例103)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.14-2.26 (4H, m), 2.01 (3H, s), 2.52-3.10 (2H, m), 3.01-5.28 (3H, m), 3.61 (3H, s), 6.48-7.88 (10H, m), 8.50-13.9 (1H, m)。

【0780】NMR 59) (実施例104)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.18-2.32 (4H, m), 2.57-3.09 (2H, m), 3.10-5.29 (3H, m), 3.66及び3.81 (各3H, 各s), 6.45-7.80 (10H, m), 8.03-13.80 (1H, m)。

【0781】NMR 60) (実施例105)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.13-2.37 (4H, m), 2.14 (3H, s), 2.54-2.97 (2H, m), 2.98-5.20 (3H, m), 3.68及び3.74 (各3H, 各s), 6.50-7.52 (10H, m)。

【0782】NMR 61) (実施例106)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.41-4.06 (5H, m), 2.13 (3H, s), 3.39 (3H, s), 4.36-5.41 (1H, m), 6.49 (1H, s), 6.79 (1H, d, J=8.44Hz), 6.88 (1H, d, J=7.42Hz), 7.01-7.62 (6H, m), 7.79 (1H, d, J=2.24Hz)。

【0783】NMR 62) (実施例107)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.10-2.21 (5H, m), 2.51-3.26

(3H, m), 3.27-4.11 (4H, m), 3.77 (3H, s), 4.36-4.88 (4H, m), 5.71-7.58 (10H, m)。

【0784】NMR 63) (实施例108)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.06-2.21 (4H, m), 2.49-5.23 (11H, m), 3.73 (3H, s), 5.78-7.50 (9H, m)。

【0785】NMR 64) (实施例110)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.04-2.26 (4H, m), 2.47-5.20 (14H, m), 5.58-7.72 (10H, m)。

【0786】NMR 65) (实施例111)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.31-1.69 (1H, m), 1.70-2.24 (3H, m), 2.55-3.20 (3H, m), 4.88-5.20 (1H, m), 5.03 (2H, s), 6.51-7.51 (16H, m)。

【0787】NMR 66) (实施例113)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.15-2.40 (4H, m), 2.28 (3H, s), 2.60-5.29 (5H, m), 3.74 (3H, s), 6.54-6.78 (1H, m), 6.88-7.06 (1H, m), 7.09-7.46 (6H, m), 7.58-7.79 (1H, m), 8.46-8.66 (1H, m)。

【0788】NMR 67) (实施例116)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.10-2.30 (4H, m), 2.49-5.29 (5H, m), 3.70 (3H, s), 3.87 (2H, s), 6.41-7.75 (12H, m)。

【0789】NMR 68) (实施例119)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: (CDCl₃): 1.21-2.31 (4H, m), 2.60-5.27 (5H, m), 3.75 (3H, s), 6.41-6.63 (1H, m), 6.80-7.53 (2H, m), 7.48 (2H, d, J=8.24Hz), 7.74 (2H, d, J=8.42Hz), 9.99-10.02 (1H, m)。

【0790】NMR 69) (实施例121)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.16-5.23 (17H, m), 2.35 (3H, s), 6.41-6.62 (1H, m), 6.78-7.53 (2H, m), 7.61 (2H, d, J=8.3Hz), 7.73 (2H, d, J=8.3Hz), 9.94 (1H, s)。

【0791】NMR 70) (实施例122)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.90-5.24 (26H, m), 6.40-6.61 (1H, m), 6.74-7.82 (6H, m),

9.88-10.01 (1H, m)。

【0792】NMR 71) (实施例123)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.94 (3H, t, J=7.3Hz), 0.78-5.25 (26H, m), 6.48-7.82 (11H, m), 12.35-13.74 (1H, m)。

【0793】NMR 72) (实施例125)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.85-5.23 (28H, m), 6.37-7.80 (10H, m), 12.29-13.40 (1H, m)。

【0794】NMR 73) (实施例126)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.02-5.22 (27H, m), 6.37-7.76 (11H, m), 12.54-13.50 (1H, m)。

【0795】NMR 74) (实施例130)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.08-2.37 (4H, m), 2.51-5.45 (11H, m), 3.83 (3H, s), 6.34-7.62 (10H, m)。

【0796】NMR 75) (实施例132)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.11-2.32 (4H, m), 2.12 (3H, s), 2.41-5.30 (7H, m), 6.38-8.08 (11H, m), 8.91-13.00 (1H, m)。

【0797】NMR 76) (实施例136)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.03-2.36 (4H, m), 2.13 (3H, s), 2.38-5.28 (7H, m), 3.71 (3H, s), 6.41-8.09 (11H, m)。

【0798】NMR 77) (实施例137)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.05-5.10 (25H, m), 6.05-7.50 (15H, m)。

【0799】NMR 78) (实施例138)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.03-5.08 (20H, m), 2.34 (3H, s), 6.58-7.53 (6H, m), 8.39-9.04 (1H, m)。

【0800】NMR 79) (实施例24)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.78-5.25 (23H, m), 2.96及び3.20 (全3H, s), 3.71 (3H, s), 3.83 (3H, s), 6.51-7.18 (6H, m)。

【0801】NMR 80) (实施例52)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.12-2.36 (4H, m), 2.20 (3H, s), 2.56-4.00 (4H, m), 4.25-

5. 41 (1H, m), 6. 27-7. 76 (11H, m), 10. 73-11. 74 (1H, m)。

【0802】NMR 81) (実施例54)

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 3-1. 7 (1H, m), 1. 7-2. 2 (3H, m), 2. 55-3. 2 (3H, m), 4. 85-5. 2 (1H, m), 6. 3-7. 7 (14H, m)。

【0803】NMR 82) (実施例55)

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 07-2. 04 (10H, m), 2. 58-3. 98 (18H, m), 4. 13-4. 36 (1H, m), 4. 73 (2H, s), 6. 61-7. 43 (10H, m), 7. 87-8. 01 (1H, m), 9. 21 (1H, s), 10. 32 (1H, brs)。

【0804】NMR 83) (実施例56)

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 05-2. 06 (10H, m), 2. 43-3. 80 (15H, m), 4. 17-4. 40 (1H, m), 4. 73 (2H, m), 6. 63-7. 48 (10H, m), 7. 84-7. 98 (1H, m), 8. 56-8. 71 (1H, m), 9. 22 (1H, s), 10. 34 (1H, brs)。

【0805】NMR 84) (実施例57)

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 08-2. 02 (10H, m), 2. 62-3. 99 (18H, m), 4. 12-4. 39 (1H, m), 4. 82 (2H, s), 6. 61-7. 57 (9H, m), 7. 96-8. 11 (1H, m), 9. 33 (1H, s), 10. 21 (1H, brs)。

【0806】NMR 85) (実施例58)

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1. 04-2. 01 (10H, m), 2. 43-3. 80 (15H, m), 4. 13-4. 40 (1H, m), 4. 82 (2H, s), 6. 60-7. 53 (9H, m), 7. 92-8. 08 (1H, m), 8. 56-8. 71 (1H, m), 9. 33 (1H, s), 10. 35 (1H, brs)。

【0807】実施例139

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチル]-N-トリフルオロアセチルアミノ}ベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 45gのメタノール20ml溶液に、炭酸カリウム0. 11gの水溶液5mlを加え室温にて12時間攪拌した。メタノールを大半留去し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。溶媒を乾燥後、減圧留去した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=80: 1→50: 1→30: 1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにて再結晶して、0. 12gの7-

クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{2-(2-メチルフェノキシ)エチルアミノ}ベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0808】白色粉末状、mp: 160-161℃。

【0809】実施例140

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-トリフルオロアセチルアミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 4gの乾燥テトラヒドロフラン20ml溶液へ、トリフェニルホスフィン0. 54g、o-(2-ヒドロキシエトキシ)トルエン0. 29gを室温にて加え、次にジエチルアゾジカルボキシレート0. 32mlの乾燥テトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、室温にて16時間攪拌した。水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を乾燥後、溶媒留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=50: 1→30: 1)に付し、0. 46gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-{N-[2-(2-メチルフェノキシ)エチル]-N-トリフルオロアセチルアミノ}ベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0810】無色不定形

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 05~5. 10 (25H, m), 6. 05-7. 50 (15H, m)。

【0811】適当な出発原料を用い、実施例140と同様にして前記実施例13~16、74~78、108及び110の化合物を得た。

【0812】実施例141

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2. 0gのピリジン30ml溶液へ、氷冷下、無水トリフルオロ酢酸1. 14mlを滴下した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。水洗乾燥後、留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; ジクロロメタン: メタノール=50: 1→30: 1)に付し、アセトン-n-ヘキサンにより結晶化し、1. 86gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-トリフルオロアセチルアミノベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0813】白色粉末状

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 03~5. 08 (20H, m), 2. 34 (3H,

s), 6.58~7.53 (6H, m), 8.39~9.04 (1H, m)。

【0814】適当な出発原料を用い、実施例141と同様にして前記実施例7、8及び55~58の化合物を得た。

【0815】実施例142

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.8gのメタノール30ml溶液へ、o-トルアルデヒド0.35ml及び酢酸1mlを加え、50~60℃で2~3時間攪拌後、水素化シアノホウ素ナトリウム0.11gを室温にて加え、2時間攪拌した。メタノールを減圧留去し、水を加えて酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を乾燥後留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=50:1→25:1)に付し、アセトン-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.71gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[2-メトキシ-4-(2-メチルベンジルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0816】白色粉末状、mp:153-154.5℃。

【0817】適当な出発原料を用い、実施例142と同様にして前記実施例13~16、75~78、108、110及び137の化合物を得た。

【0818】実施例143

7-クロロ-5-メトキシカルボニルメチル-1-(2-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン2.6gのエタノール100ml懸濁液に炭酸ナトリウム1.5g、o-キシレンジブromaid1.87g及び沃化ナトリウム2.42gを加え、60~70℃にて、3時間攪拌した。エタノールを減圧留去し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を乾燥後、減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:5)に付し、0.32gの7-クロロ-5-メトキシカルボニルメチル-1-[2-メトキシ-4-(2-イソインドリニル)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0819】無色不定形

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.10-2.21 (5H, m), 2.51-3.26 (3H, m), 3.27-4.11 (4H, m), 3.77 (3H, s), 4.36-4.88 (4H, m), 5.71-7.58 (10H, m)。

【0820】実施例143と同様にして適当な出発原料を用いて前記実施例79、及び101の化合物を得た。

【0821】実施例144

7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-ヒドロキシベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7gの乾燥ジメチルホルムアミド20ml溶液へ、炭酸カリウム0.35g及び2-クロロベンジルクロリド0.32mlを加え、室温にて一晩攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。水洗乾燥後、溶媒留去し、アセトン-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.76gの7-クロロ-1-[3-メトキシ-4-(2-クロロベンジルオキシ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0822】白色粉末状、mp:135℃。

【0823】適当な出発原料を用い、実施例144と同様にして前記実施例24~33、41、43~45、47、49~51、86~88及び98の化合物を得た。

【0824】実施例145

7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-(4-ホルミルベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.29gのメタノール30ml溶液に、o-トルイジン0.2ml及び酢酸をpH4になるまで加え、50℃で8時間加熱攪拌後、氷冷下、水素化シアノホウ素ナトリウム0.085gを加え、1時間攪拌した。メタノールを減圧留去後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。水洗乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=100:1→50:1)に付し、0.1gの7-クロロ-5-[(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニルメチル]-1-[4-(2-メチルアニリノメチル)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【0825】無色不定形

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.10-5.24 (26H, m), 6.32-7.69 (11H, m)。

【0826】適当な出発原料を用い、実施例145と同様にして前記実施例36の化合物を得た。

【0827】実施例146

7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-アミノベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.7gのピリジン5ml溶液に、N,N-ジメチルカルバミン酸クロリド0.42mlを加え、60~70℃にて、2時間攪拌した。塩酸酸性とし、酢酸エチルにて抽出した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:1→3:1)に付し、エタノール-ジエチルエーテルにて再結晶して、0.33gの7-クロロ-1-(3-メトキシ-4-ジメチルアミノカルボニルアミノ

ベンゾイル) -2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-
ベンゾアゼピンを得た。

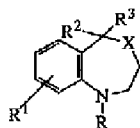
【0828】 mp : 230 ~ 232 °C、白色板状。

【0829】 適当な出発原料を用い、実施例1及び2と

同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【0830】

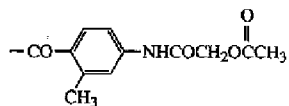
【表125】



実施例 147

構造

R :



X : -CH₂- R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

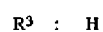
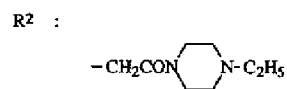
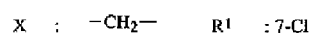
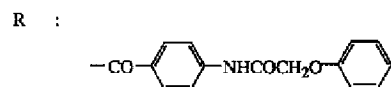
結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【0831】

【表126】

实施例 148

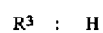
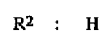
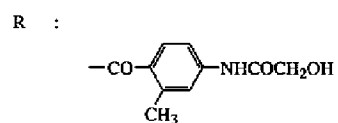
構造



結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 149

構造



結晶形 : 白色粉末状
融点 : 194 - 195℃
形態 : 遊離

【0832】

【表127】

実施例 150

構造

R :



X :



R¹ : 7-Cl

R² :



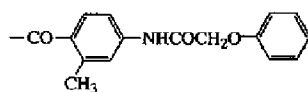
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 151

構造

R :

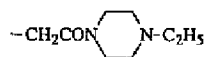


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

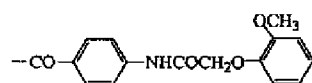
【0833】

【表128】

實施例 152

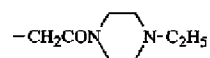
構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² :



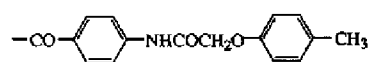
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 153

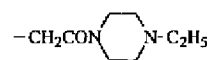
構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

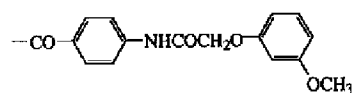
【0834】

【表129】

実施例 154

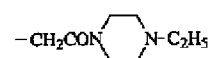
構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² :



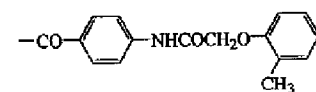
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 155

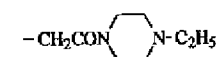
構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

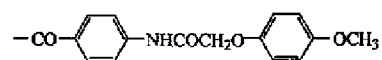
【0835】

【表130】

実施例 156

構造

R :

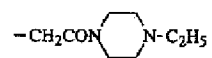


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

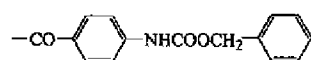
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 157

構造

R :

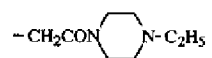


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

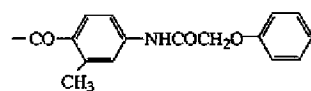
【0836】

【表131】

実施例 158

構造

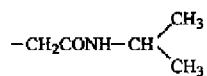
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

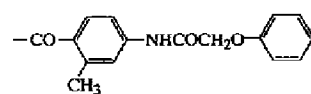
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 159

構造

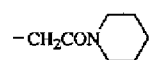
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

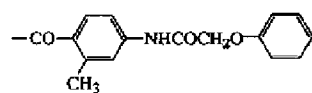
【0837】

【表132】

实施例 160

構造

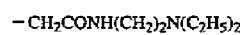
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

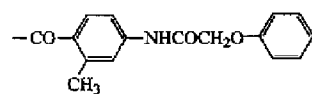
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 161

構造

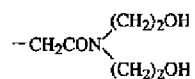
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

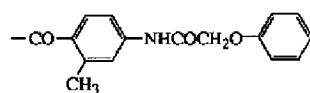
【0838】

【表133】

实施例 162

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

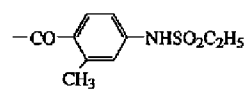
R³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

实施例 163

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

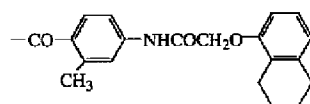
【0839】

【表134】

实施例 164

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

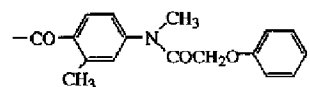
融点 : 230 - 232°C (分解)

形態 : 遊離

实施例 165

構造

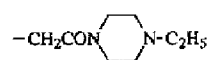
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

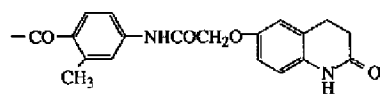
【0840】

【表135】

實施例 166

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

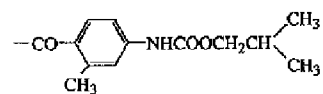
R³ : H

結晶形 : 白色粉末狀
融点 : 243 - 245℃ (分解)
形態 : 遊離

實施例 167

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

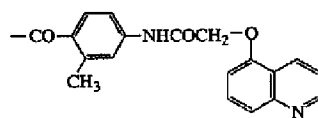
【0841】

【表136】

实施例 168

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

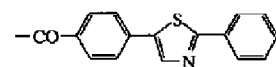
R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
融点 : 203 - 205℃ (分解)
形態 : 遊離

实施例 169

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 褐色粉末状
融点 : 178 - 180℃
形態 : 遊離

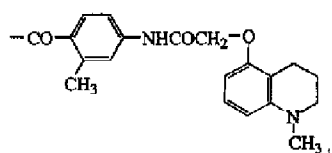
【0842】

【表137】

实施例 170

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

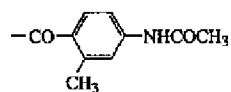
融点 : 202 - 204℃ (分解)

形態 : 遊離

实施例 171

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 118 - 120℃

形態 : 遊離

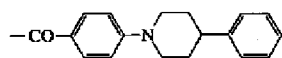
【0843】

【表138】

实施例 172

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

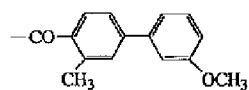
融点 : 179 - 181℃ (分解)

形態 : 遊離

实施例 173

構造

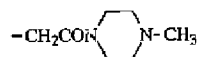
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

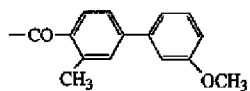
【0844】

【表139】

実施例 174

構造

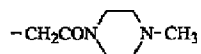
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



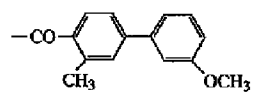
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 175

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【 0 8 4 5 】

【 表 1 4 0 】

実施例 176

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 177

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

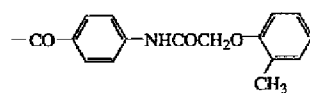
【0846】

【表141】

实施例 178

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 179

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

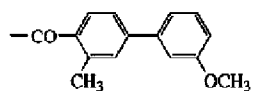
【0847】

【表142】

実施例 180

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

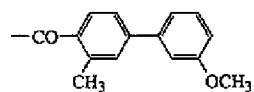
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 181

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

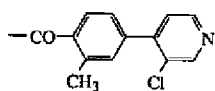
【 0 8 4 8 】

【 表 1 4 3 】

实施例 182

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

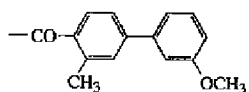
R³ : H

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

实施例 183

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

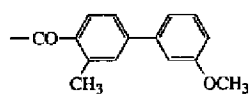
【0849】

【表144】

实施例 184

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

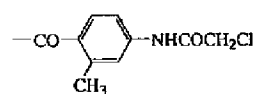
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 185

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

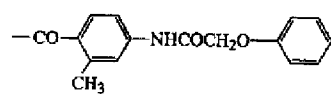
【0850】

【表145】

實施例 186

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

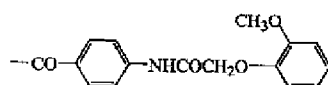
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 187

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

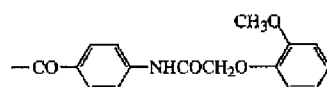
【0851】

【表 146】

實施例 188

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

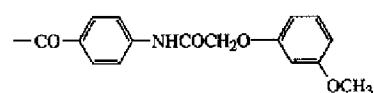
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 189

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

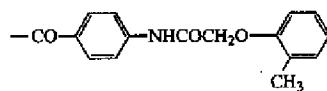
【0852】

【表147】

実施例 190

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

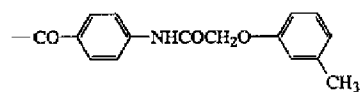
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 191

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 130 - 132℃
形態 : 遊離

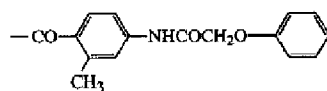
【0853】

【表148】

實施例 192

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

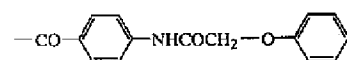
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 193

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【0854】

【表149】

实施例 194

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

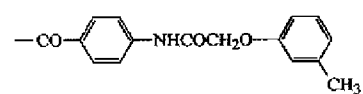
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 195

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

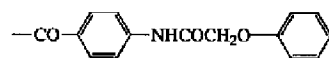
【0855】

【表150】

実施例 196

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

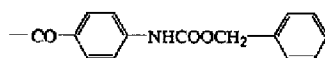
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 197

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

【0856】

【表151】

实施例 198

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

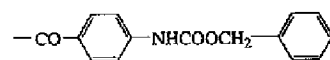
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 199

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

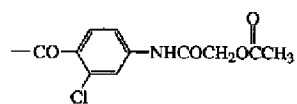
【0857】

【表152】

実施例 200

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

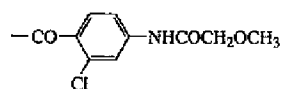
融点 (℃) : 188 - 190

形態 : 遊離

実施例 201

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

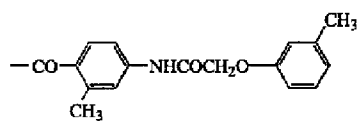
【0858】

【表153】

實施例 202

構造

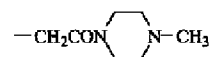
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



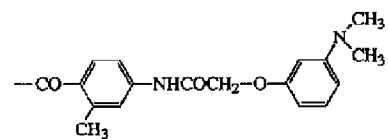
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

實施例 203

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

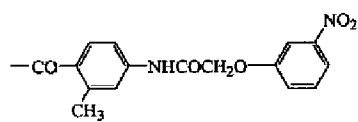
【0859】

【表154】

実施例 204

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

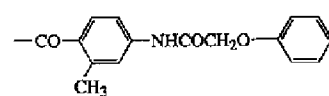
融点 : 186.5 - 188℃

形態 : 遊離

実施例 205

構造

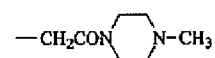
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

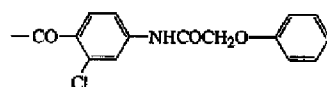
【0860】

【表155】

实施例 206

構造

R :

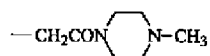


X :



R¹ : H

R² :



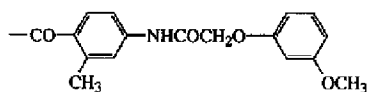
R³ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : HCl

实施例 207

構造

R :

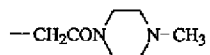


X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

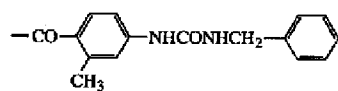
【0861】

【表156】

实施例 208

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² :



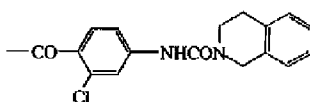
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 209

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

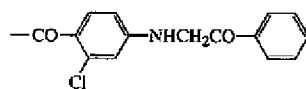
【0862】

【表157】

実施例 210

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

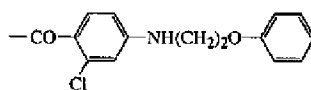
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 211

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

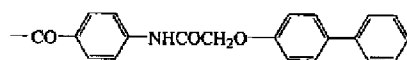
【0863】

【表158】

実施例 212

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

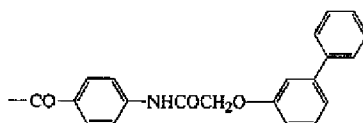
R³ : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 204 - 205℃
形態 : 遊離

実施例 213

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 157.5 - 159℃
形態 : 遊離

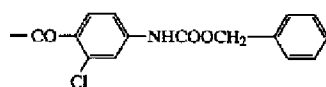
【0864】

【表159】

実施例 214

構造

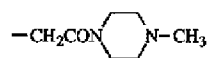
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



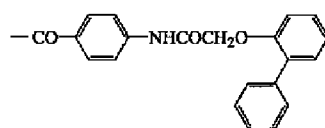
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 215

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 168 - 169.5℃
形態 : 遊離

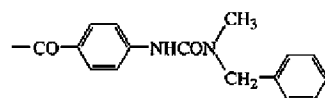
【0865】

【表160】

実施例 216

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

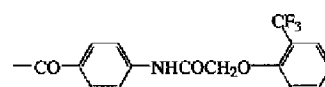
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 217

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジエチルエーテル洗淨

融点 : 195.5 - 197℃

形態 : 遊離

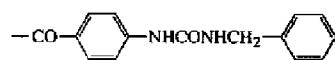
【0866】

【表161】

実施例 218

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

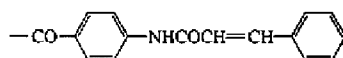
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 219

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-*n*-ヘキサン洗滌

融点 : 234 - 234.5℃

形態 : 遊離

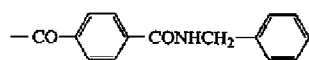
【0867】

【表162】

実施例 220

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 221

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗淨
融点 : 143・144.5℃
形態 : 遊離

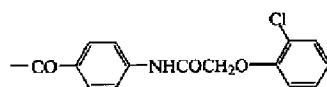
【0868】

【表163】

実施例 222

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

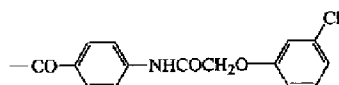
R³ : H

結晶形 : 微橙色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル洗浄
融点 : 231.5 - 233℃
形態 : 遊離

実施例 223

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 164 - 165℃
形態 : 遊離

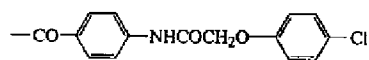
【0869】

【表164】

実施例 224

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : H

R² : H

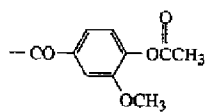
R³ : H

結晶形 : 微橙色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 175 - 176.5℃
形態 : 遊離

実施例 225

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 127.5 - 128.5℃
形態 : 遊離

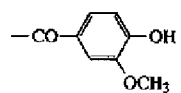
【0870】

【表165】

実施例 226

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

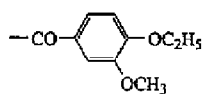
融点 : 176 - 177℃

形態 : 遊離

実施例 227

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 104.5 - 105.5℃

形態 : 遊離

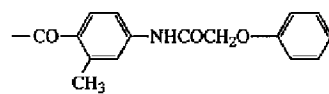
【0871】

【表166】

実施例 228

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

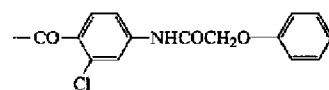
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 229

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

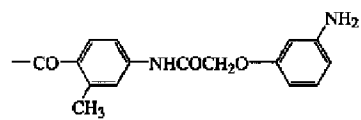
【0872】

【表167】

实施例 230

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

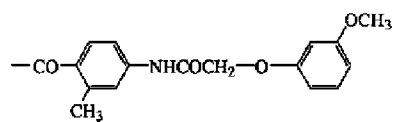
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

实施例 231

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

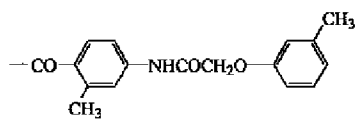
【0873】

【表168】

实施例 232

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

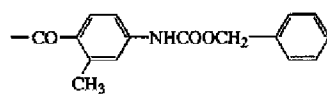
結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

实施例 233

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

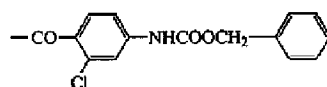
【0874】

【表169】

实施例 234

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

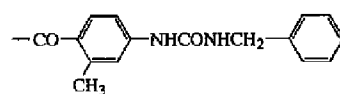
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 235

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

R³ : H

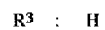
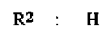
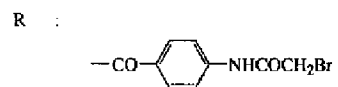
結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【0875】

【表170】

実施例 236

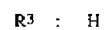
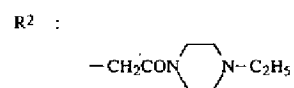
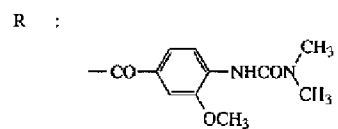
構造



結晶形 : 茶色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗淨
融点 : 156 - 159℃
形態 : 遊離

実施例 237

構造



結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

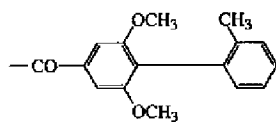
【 0 8 7 6 】

【 表 1 7 1 】

实施例 238

構造

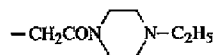
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

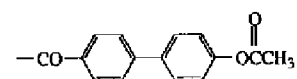
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 239

構造

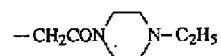
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

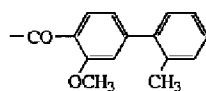
【0877】

【表172】

实施例 240

構造

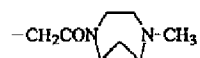
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

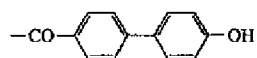
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 241

構造

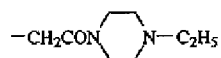
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

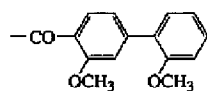
【0878】

【表173】

實施例 242

構造

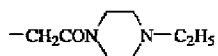
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



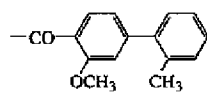
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

實施例 243

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

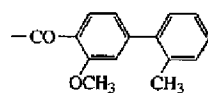
【0879】

【表174】

實施例 244

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{OCH}_2\text{COOH}$

R³ : H

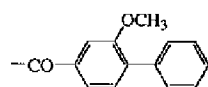
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 245

構造

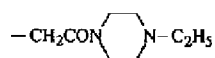
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

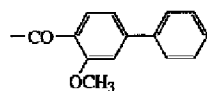
【0880】

【表175】

実施例 246

構造

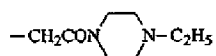
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



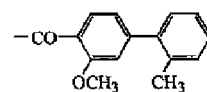
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 247

構造

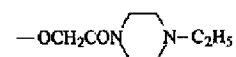
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

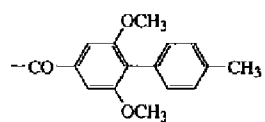
【0881】

【表176】

実施例 248

構造

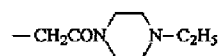
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

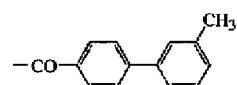
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 249

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒: アセトン-n-ヘキサン

融点 : 84 - 85.5℃

形態 : 遊離

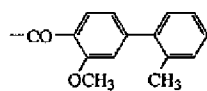
【0882】

【表177】

実施例 250

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

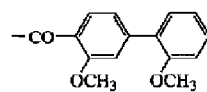
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 251

構造

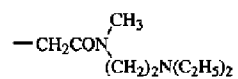
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

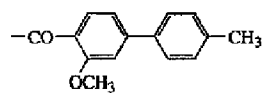
【0883】

【表178】

實施例 252

構造

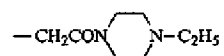
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

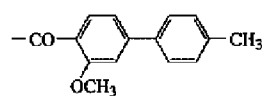
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 253

構造

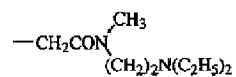
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

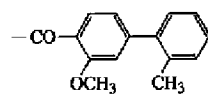
【0884】

【表179】

実施例 254

構造

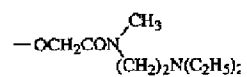
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

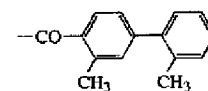
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 255

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

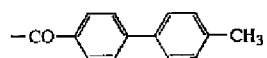
【0885】

【表180】

実施例 256

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

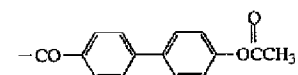
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 181.5 - 182℃
形態 : 遊離

実施例 257

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

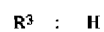
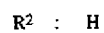
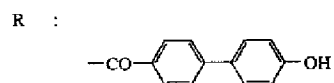
結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 181 - 182℃
形態 : 遊離

【0886】

【表181】

実施例 258

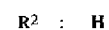
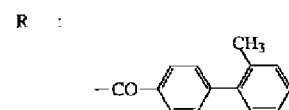
構造



結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 262 - 265℃
形態 : 遊離

実施例 259

構造



結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 159 - 160℃
形態 : 遊離

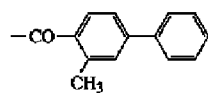
【0887】

【表182】

実施例 260

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

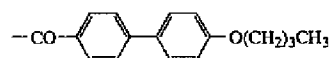
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 261

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 153℃
形態 : 遊離

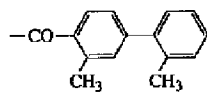
【0888】

【表183】

实施例 262

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

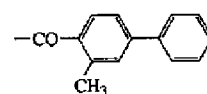
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 263

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

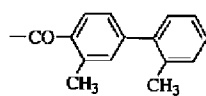
【0889】

【表184】

実施例 264

構造

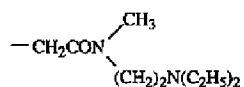
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

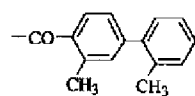
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 265

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

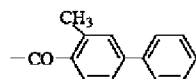
【0890】

【表185】

实施例 266

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

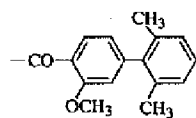
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 267

構造

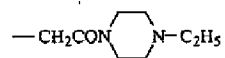
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

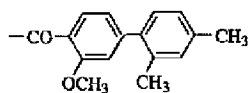
【0891】

【表186】

实施例 268

構造

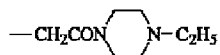
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

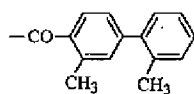
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 269

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

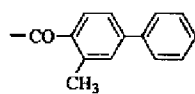
【0892】

【表187】

実施例 270

構造

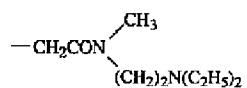
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



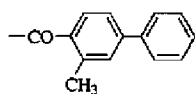
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 271

構造

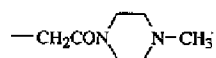
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

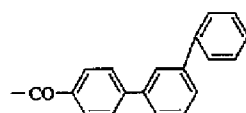
【0893】

【表188】

実施例 272

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

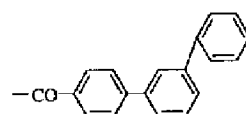
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 273

構造

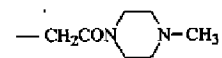
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

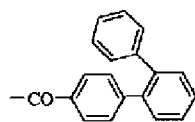
【0894】

【表189】

實施例 274

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



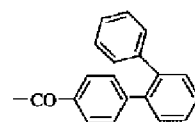
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

實施例 275

構造

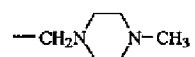
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

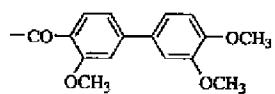
【0895】

【表190】

実施例 276

構造

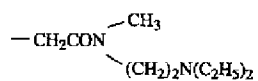
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

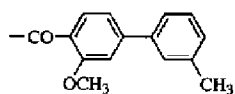
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 277

構造

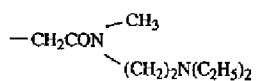
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

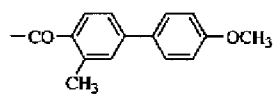
【0896】

【表191】

実施例 278

構造

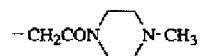
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

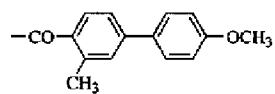
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 279

構造

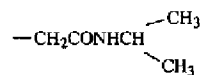
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

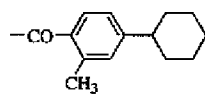
【0897】

【表192】

実施例 280

構造

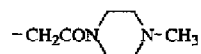
R :



X : -CH₂-

R¹ : H

R² :



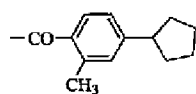
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-n-ヘキサン
融点 : 218 - 221℃
形態 : HCl

実施例 281

構造

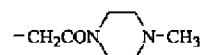
R :



X : -CH₂-

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 214 - 217℃
形態 : HCl

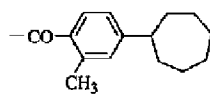
【0898】

【表193】

実施例 282

構造

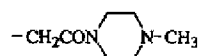
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



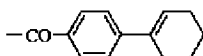
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 204 - 206℃
形態 : HCl

実施例 283

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

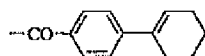
【0899】

【表194】

實施例 284

構造

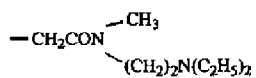
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



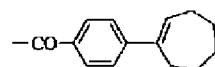
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

實施例 285

構造

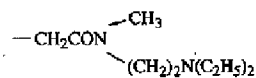
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

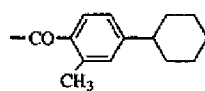
【0900】

【表195】

實施例 286

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

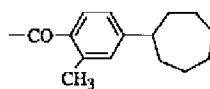
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 287

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

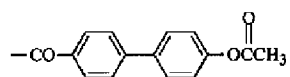
【0901】

【表196】

實施例 288

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

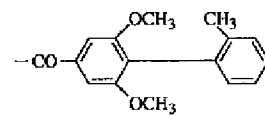
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 289

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

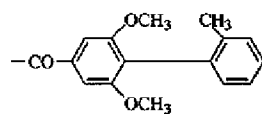
【0902】

【表197】

実施例 290

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

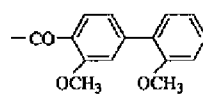
融点 : 240 - 242°C

形態 : 遊離

実施例 291

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

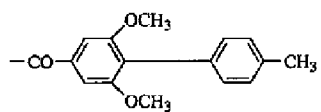
【0903】

【表198】

實施例 292

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

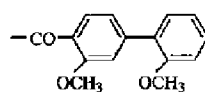
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 293

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

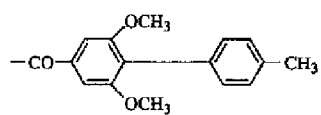
【0904】

【表199】

実施例 294

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

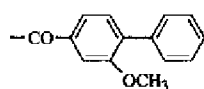
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 295

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

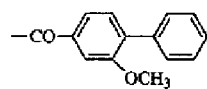
【0905】

【表200】

実施例 296

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

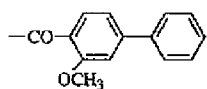
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 297

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

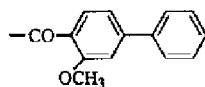
【0906】

【表201】

実施例 298

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

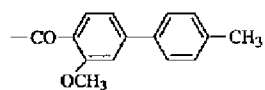
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 299

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

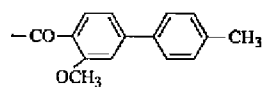
【0907】

【表202】

実施例 300

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

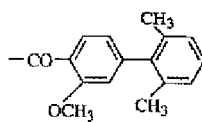
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 301

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

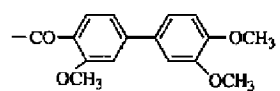
【0908】

【表203】

実施例 302

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

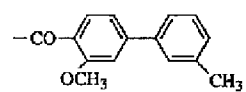
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 303

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

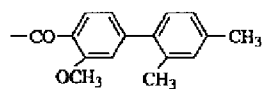
【0909】

【表204】

実施例 304

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

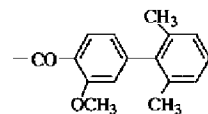
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 305

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン
融点 : 251 - 253℃
形態 : 遊離

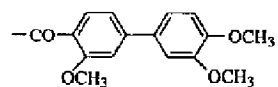
【0910】

【表205】

実施例 306

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

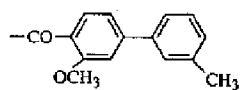
融点 : 128 - 131℃

形態 : 遊離

実施例 307

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

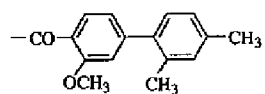
【0911】

【表206】

実施例 308

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : エタノール

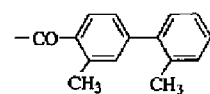
融点 : 224 - 225℃

形態 : 遊離

実施例 309

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

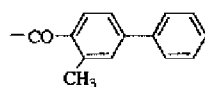
【0912】

【表207】

実施例 310

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

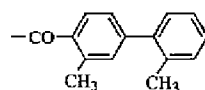
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 311

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

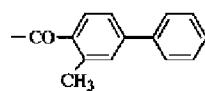
【0913】

【表208】

實施例 312

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

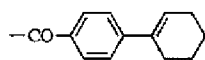
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 313

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

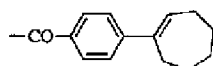
【0914】

【表209】

実施例 314

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

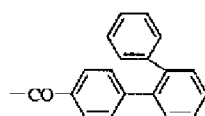
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 315

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

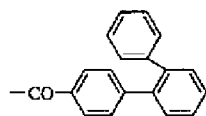
【0915】

【表210】

実施例 316

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

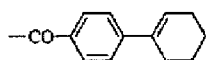
R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 124 - 128℃
形態 : 遊離

実施例 317

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

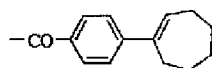
【0916】

【表211】

實施例 318

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

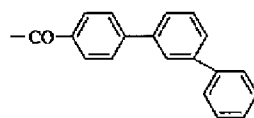
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 319

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

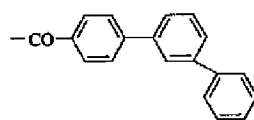
【0917】

【表212】

実施例 320

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

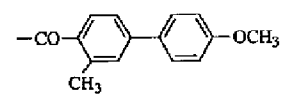
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 321

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

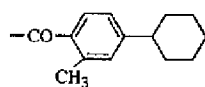
【0918】

【表213】

実施例 322

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

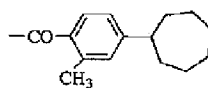
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 323

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

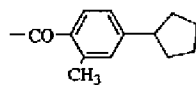
【0919】

【表214】

实施例 324

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

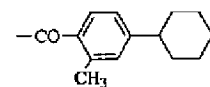
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 325

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

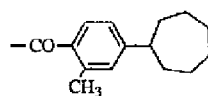
【0920】

【表2-1-5】

实施例 326

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

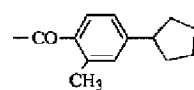
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 327

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

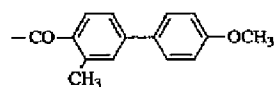
【0921】

【表216】

实施例 328

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

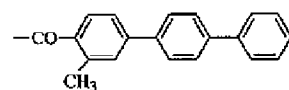
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 329

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

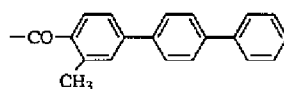
【0922】

【表217】

実施例 330

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

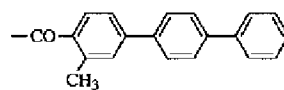
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 203 - 204℃
形態 : 遊離

実施例 331

構造

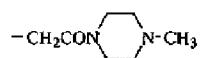
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン-*n*-ヘキサン
融点 : 255 - 258℃
形態 : HCl

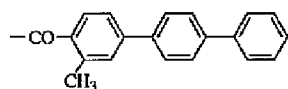
【 0 9 2 3 】

【 表 2 1 8 】

實施例 332

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

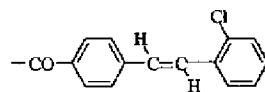
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 333

構造

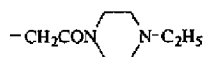
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色油狀
形態 : 遊離

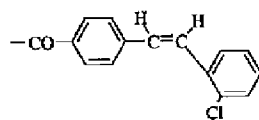
【0924】

【表219】

実施例 334

構造

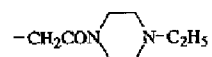
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

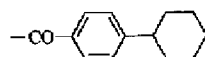
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 335

構造

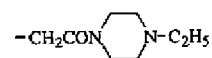
R :



X : $=\text{CH}-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【0925】

【表220】

實施例 336

構造

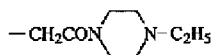
R :



X : $=CH-$

R¹ : 7-Cl

R² :



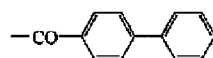
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

實施例 337

構造

R :



X : $=CH-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-CH_2CONH(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

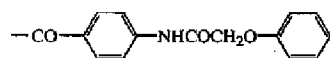
【0926】

【表221】

实施例 338

構造

R :

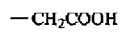


X :



R¹ : H

R² :



R³ :



結晶形 : 白色粉末状

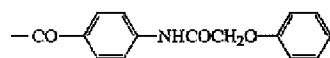
融点 : 102 - 106℃

形態 : 遊離

实施例 339

構造

R :

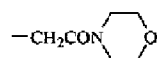


X :



R¹ : H

R² :



R³ :



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

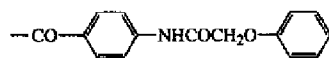
【0927】

【表222】

實施例 340

構造

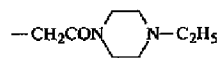
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

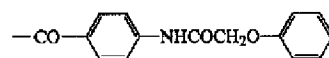
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 341

構造

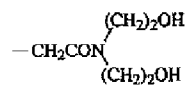
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

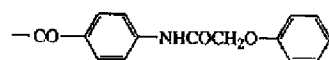
【0928】

【表223】

実施例 342

構造

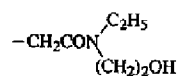
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



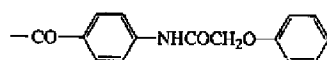
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 343

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 190-193℃
形態 : 遊離

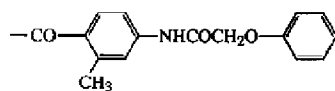
【0929】

【表224】

實施例 344

構造

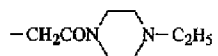
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

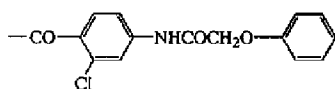
結晶形 : 無色油狀

形態 : 遊離

實施例 345

構造

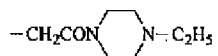
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油狀

形態 : 遊離

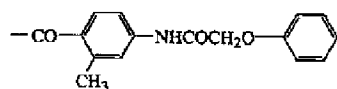
【0930】

【表225】

実施例 346

構造

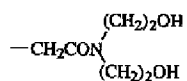
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



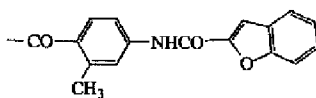
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 347

構造

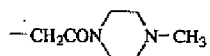
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル
融点 : 180 - 182℃
形態 : 遊離

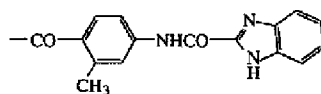
【0931】

【表226】

実施例 348

構造

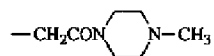
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジクロロメタン-ジエチルエーテル

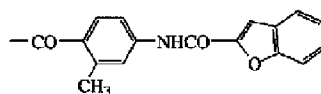
融点 : 239 - 241℃

形態 : 遊離

実施例 349

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 252 - 254℃

形態 : 遊離

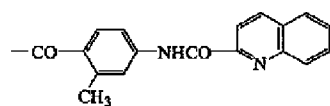
【0932】

【表227】

实施例 350

構造

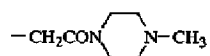
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



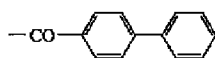
R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状
形態 : 遊離

实施例 351

構造

R :



X : $=\text{CH}-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
融点 : 71 - 75℃
形態 : 遊離

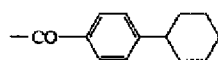
【0933】

【表228】

实施例 352

構造

R :



X : =CH—

R¹ : 7-Cl

R² : —CH₂CO₂C₂H₅

R³ : H

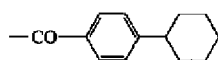
結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

实施例 353

構造

R :



X : =CH—

R¹ : 7-Cl

R² : —CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

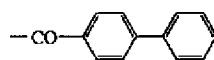
【0934】

【表229】

实施例 354

構造

R :



X : =CH-

R¹ : 7-Cl

R² : $\text{-CH}_2\text{COOH}$

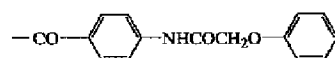
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

实施例 355

構造

R :



X : $\text{-CH}_2\text{-}$

R¹ : H

R² : $\text{-CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 63 - 69℃
形態 : 遊離

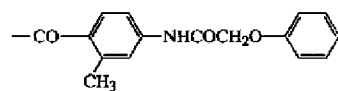
【0935】

【表230】

实施例 356

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

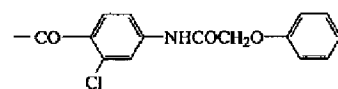
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

实施例 357

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

形態 : 遊離

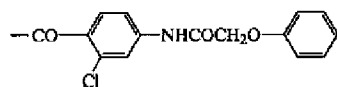
【0936】

【表231】

实施例 358

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

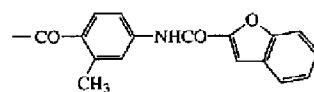
R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状
形態 : 遊離

实施例 359

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状
形態 : 遊離

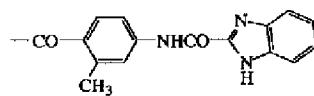
【0937】

【表232】

实施例 360

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

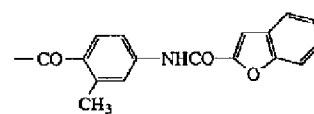
R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油状
形態 : 遊離

实施例 361

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

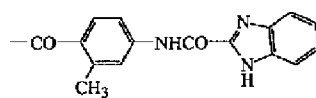
【0938】

【表233】

实施例 362

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

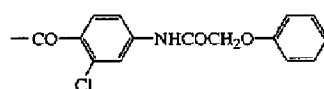
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 363

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

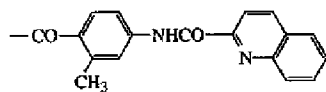
【0939】

【表234】

実施例 364

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-メタノール-ジエチルエーテル

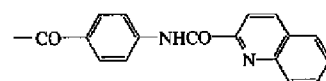
融点 : 194 - 197℃

形態 : 遊離

実施例 365

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

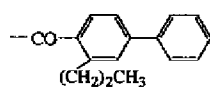
【0940】

【表235】

實施例 366

構造

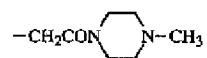
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

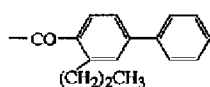
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 367

構造

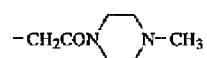
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

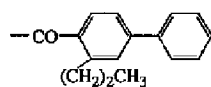
【 0 9 4 1 】

【 表 2 3 6 】

実施例 368

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

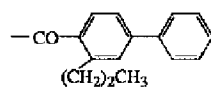
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 134 - 136℃
形態 : 遊離

実施例 369

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 97 - 100℃
形態 : 遊離

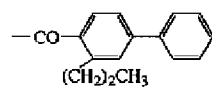
【 0 9 4 2 】

【 表 2 3 7 】

実施例 370

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

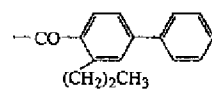
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 371

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

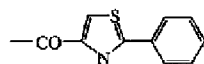
【0943】

【表238】

実施例 372

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

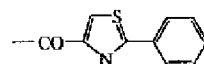
R³ : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン
融点 : 135 - 138℃
形態 : 遊離

実施例 373

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル
融点 : 136 - 139℃
形態 : 遊離

【0944】

【表239】

実施例 374

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-酢酸エチル

融点 : 143 - 145°C

形態 : 遊離

実施例 375

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

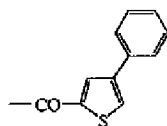
【0945】

【表240】

実施例 376

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

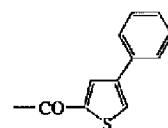
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-酢酸エチル
融点 : 123 - 125°C
形態 : 遊離

実施例 377

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

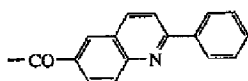
【 0 9 4 6 】

【 表 2 4 1 】

実施例 378

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

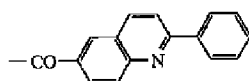
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 164 - 166°C
形態 : 遊離

実施例 379

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

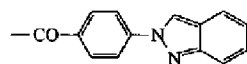
【0947】

【表242】

実施例 380

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

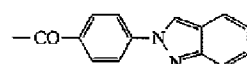
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 168 - 170℃
形態 : 遊離

実施例 381

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン
融点 : 226 - 229℃
形態 : 遊離

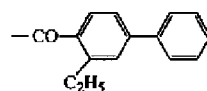
【0948】

【表243】

実施例 382

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

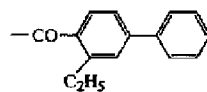
融点 : 131 - 134℃

形態 : 遊離

実施例 383

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

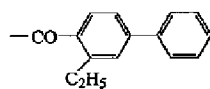
【0949】

【表244】

実施例 384

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

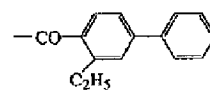
R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル
融点 : 133 - 134.5℃
形態 : 遊離

実施例 385

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

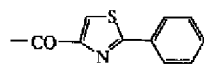
【0950】

【表245】

實施例 386

構造

R :

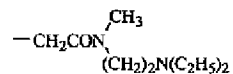


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ :

H

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

實施例 387

構造

R :

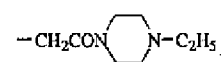


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ :

H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

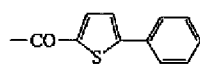
【0951】

【表246】

実施例 388

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

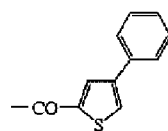
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 389

構造

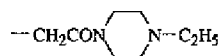
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

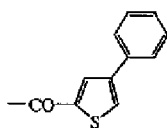
【0952】

【表247】

实施例 390

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

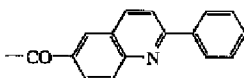
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 391

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

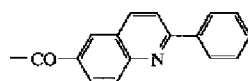
【0953】

【表248】

實施例 392

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

R³ : H

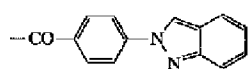
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 393

構造

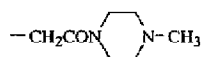
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

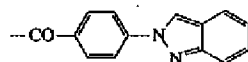
【0954】

【表249】

実施例 394

構造

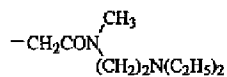
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



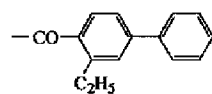
R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 395

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 : 134 - 135.5℃
形態 : 遊離

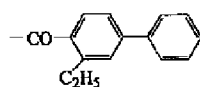
【0955】

【表250】

実施例 396

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

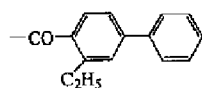
R³ : H

結晶形 : 無色針状
再結晶溶媒 : n-ヘキサン
融点 : 108 - 110.5℃
形態 : 遊離

実施例 397

構造

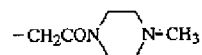
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

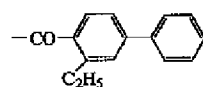
【0956】

【表251】

実施例 398

構造

R :

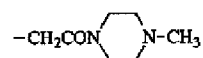


X :



R¹ : H

R² :



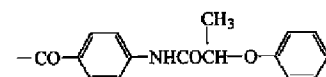
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 399

構造

R :



X :



R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 131 - 133℃
形態 : 遊離

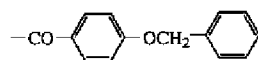
【0957】

【表252】

実施例 400

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : H

R² : H

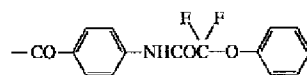
R³ : H

結晶形 : 無色鱗片状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 125 - 126℃
形態 : 遊離

実施例 401

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 134 - 135℃
形態 : 遊離

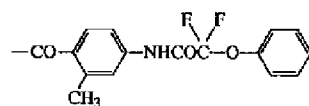
【0958】

【表253】

実施例 402

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

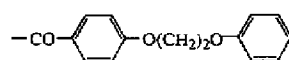
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 190 - 192℃
形態 : 遊離

実施例 403

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 139 - 142℃
形態 : 遊離

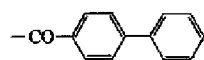
【0959】

【表254】

实施例 404

構造

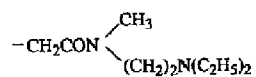
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-F

R² :



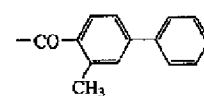
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

实施例 405

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 淡褐色粉末状
融点 : 157 - 159℃
形態 : 遊離

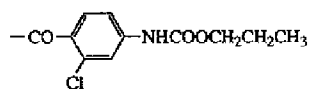
【0960】

【表255】

実施例 406

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

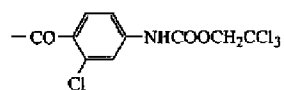
融点 : 166 - 167°C

形態 : 遊離

実施例 407

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 181 - 182°C

形態 : 遊離

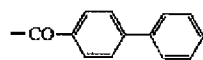
【0961】

【表256】

実施例 408

構造

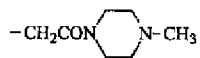
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-F

R² :



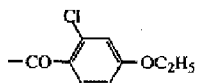
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 409

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 108 - 109℃
形態 : 遊離

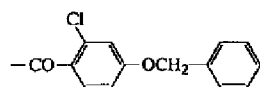
【0962】

【表257】

実施例 410

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

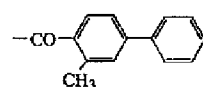
融点 : 104 - 106℃

形態 : 遊離

実施例 411

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 130 - 132℃

形態 : 遊離

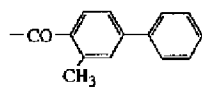
【0963】

【表258】

実施例 412

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{OH}$

R³ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

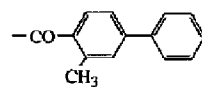
融点 : 191-193℃

形態 : 遊離

実施例 413

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{OCH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油

形態 : 遊離

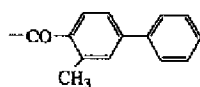
【0964】

【表259】

実施例 414

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

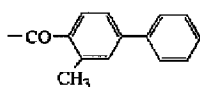
R² 及び R³: $-\text{CH}_2$

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン
融点 : 123 - 124℃
形態 : 遊離

実施例 415

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{OH}$

R³ : $-\text{CH}_2\text{OH}$

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
形態 : 遊離

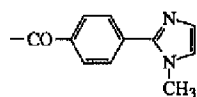
【0965】

【表260】

実施例 416

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

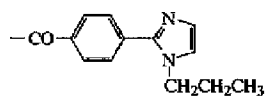
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 194 - 197℃
形態 : 遊離

実施例 417

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : HCl

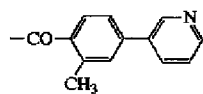
【0966】

【表261】

实施例 418

構造

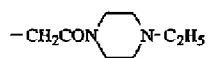
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



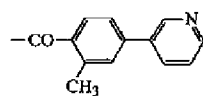
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 419

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

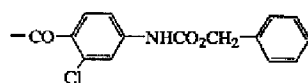
【0967】

【表262】

実施例 420

構造

R :

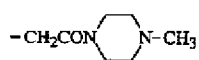


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



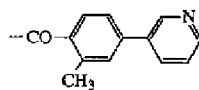
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 421

構造

R :



X :



R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡褐色不定形
形態 : HCl

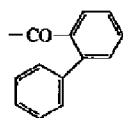
【0968】

【表263】

実施例 422

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

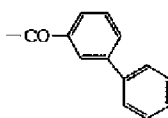
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
形態 : 遊離

実施例 423

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

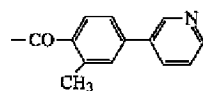
【0969】

【表264】

実施例 424

構造

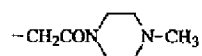
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



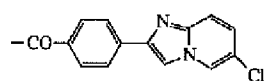
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 425

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

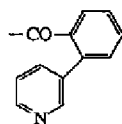
【0970】

【表265】

実施例 426

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

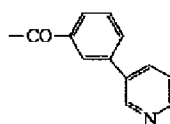
R³ : H

結晶形 : 淡褐色不定形
形態 : 遊離

実施例 427

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル
融点 : 223 - 227℃
形態 : HCl

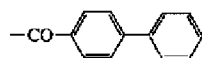
【0971】

【表266】

実施例 428

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

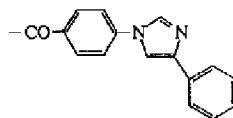
融点 : 152 - 154℃

形態 : 遊離

実施例 429

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 166 - 168℃

形態 : 遊離

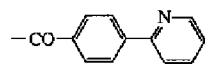
【0972】

【表267】

実施例 430

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

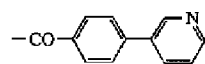
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 190 - 192℃
形態 : 遊離

実施例 431

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 185 - 187℃
形態 : 遊離

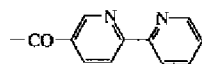
【0973】

【表268】

実施例 432

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

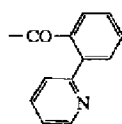
融点 : 154 - 158℃

形態 : 遊離

実施例 433

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡褐色不定形

形態 : 遊離

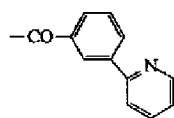
【0974】

【表269】

実施例 434

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

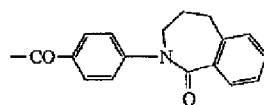
融点 : 222 - 225℃

形態 : HCl

実施例 435

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : エタノール-ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 199 - 201℃

形態 : 遊離

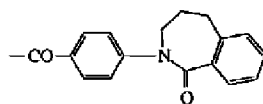
【0975】

【表270】

実施例 436

構造

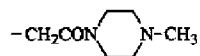
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



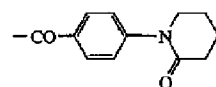
R³ : H

結晶形 : 無色粘稠油
形態 : 遊離

実施例 437

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 173-175℃
形態 : 遊離

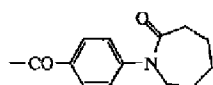
【0976】

【表271】

実施例 438

構造

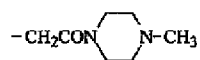
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



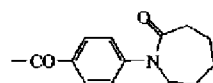
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 439

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 218 - 219℃
形態 : 遊離

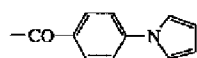
【0977】

【表272】

实施例 440

構造

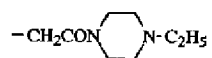
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

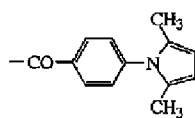
結晶形 : 黄色粘稠油

形態 : 遊離

实施例 441

構造

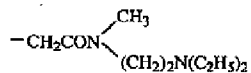
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 黄色油状

形態 : 遊離

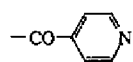
【0978】

【表273】

実施例 442

構造

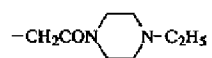
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

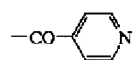
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 143 - 145°C

実施例 443

構造

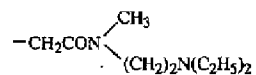
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

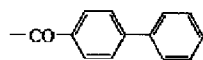
【 0 9 7 9 】

【 表 2 7 4 】

実施例 444

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-F

R² : OH

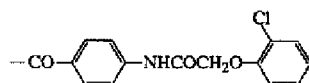
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 445

構造

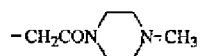
R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

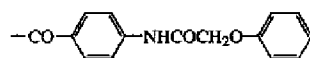
【0980】

【表275】

実施例 446

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² :



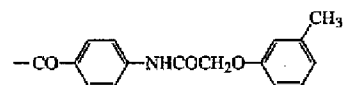
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 447

構造

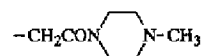
R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

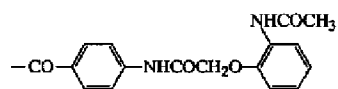
【0981】

【表276】

実施例 448

構造

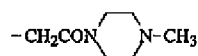
R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² :



R³ : H

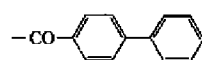
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 449

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² : -CH₂CONHCH₂CONH₂

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 208 - 209℃

形態 : 遊離

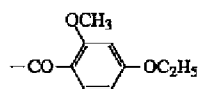
【0982】

【表277】

実施例 450

構造

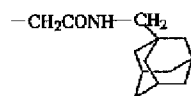
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



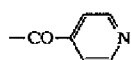
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 451

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 222 - 224℃
形態 : 遊離

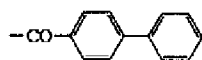
【0983】

【表278】

実施例 452

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-F

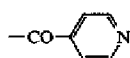
R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色鱗片状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 97 - 100℃
形態 : 遊離

実施例 453

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 116 - 118℃
形態 : 遊離

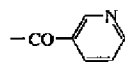
【0984】

【表279】

実施例 454

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

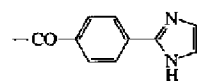
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 115 - 116℃
形態 : 遊離

実施例 455

構造

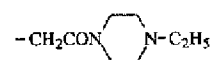
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

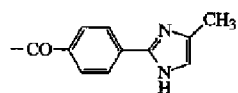
【0985】

【表280】

実施例 456

構造

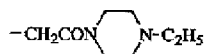
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



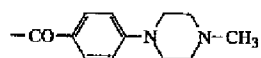
R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

実施例 457

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル-n-ヘキサン
融点 : 194 - 197℃
形態 : 遊離

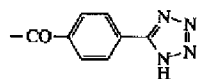
【0986】

【表281】

実施例 458

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

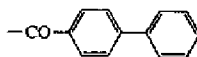
R³ : H

結晶形 : 淡褐色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 150 - 154℃
形態 : 遊離

実施例 459

構造

R :



X : 単結合

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

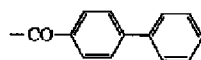
【0987】

【表282】

実施例 460

構造

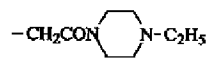
R :



X : 単結合

R¹ : H

R² :



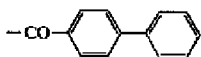
R³ : H

結晶形 : 微橙色不定形
形態 : 2HCl

実施例 461

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂CONH(CH₂)₂N(C₂H₅)₂

R³ : H

結晶形 : 微黄色不定形
形態 : 遊離

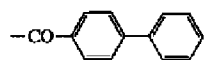
【0988】

【表283】

実施例 462

構造

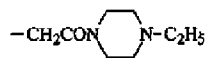
R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² :



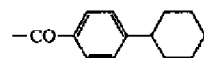
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 463

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

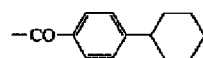
【0989】

【表284】

実施例 464

構造

R :



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² :



R³ : H

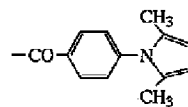
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 465

構造

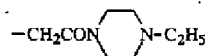
R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 154 - 156℃

形態 : 遊離

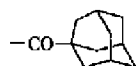
【0990】

【表285】

実施例 466

構造

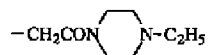
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



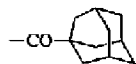
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 195 - 196℃
形態 : 遊離

実施例 467

構造

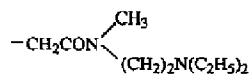
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

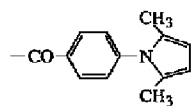
【 0 9 9 1 】

【 表 2 8 6 】

实施例 468

構造

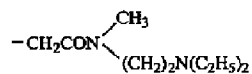
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :

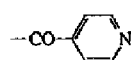


R³ : H

实施例 469

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

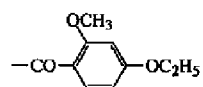
【0992】

【表287】

実施例 470

構造

R :

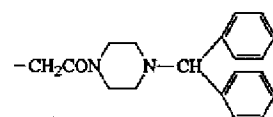


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

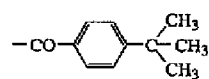
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 471

構造

R :

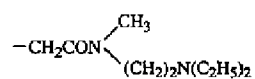


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

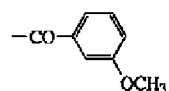
【0993】

【表288】

實施例 472

構造

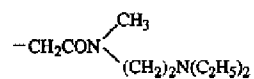
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

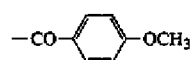
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 473

構造

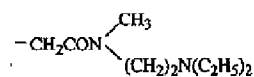
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

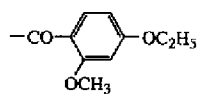
【0994】

【表289】

実施例 474

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{NHSO}_2\text{CH}_3$

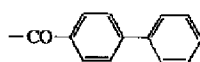
R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 158 - 159℃
形態 : 遊離

実施例 475

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{NHSO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 193 - 194℃
形態 : 遊離

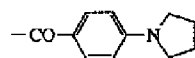
【0995】

【表290】

実施例 476

構造

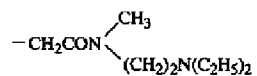
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



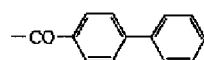
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 477

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

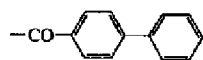
【0996】

【表291】

実施例 478

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



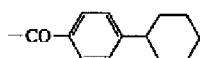
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 479

構造

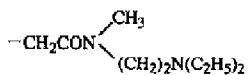
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

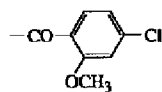
【0997】

【表292】

实施例 480

構造

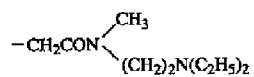
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

实施例 481

構造

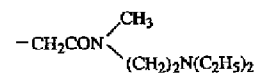
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

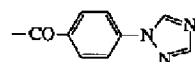
【0998】

【表293】

実施例 482

構造

R :

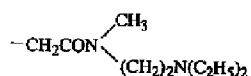


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ :

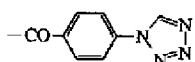
H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : HCl

実施例 483

構造

R :

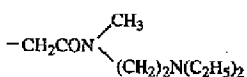


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ :

H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
融点 : 155 - 158℃
形態 : 遊離

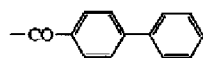
【0999】

【表294】

實施例 484

構造

R :

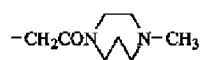


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

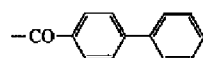
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 485

構造

R :

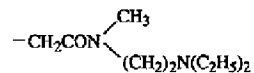


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

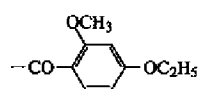
【1000】

【表295】

实施例 486

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

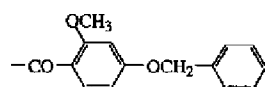
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

实施例 487

構造

R :



X : -CH₂-

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

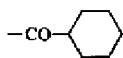
【1001】

【表296】

实施例 488

構造

R :

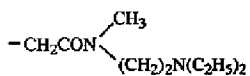


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



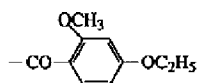
R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形
形態 : 遊離

实施例 489

構造

R :

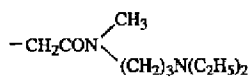


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

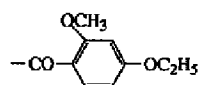
【1002】

【表297】

実施例 490

構造

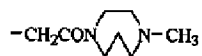
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



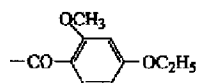
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 491

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

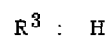
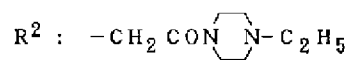
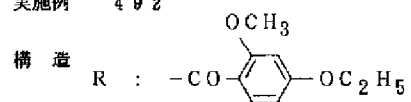
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

【1003】

【表298】

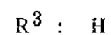
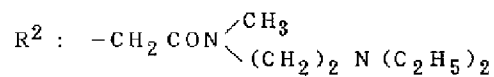
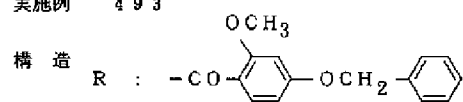
実施例 492



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 493



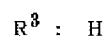
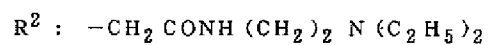
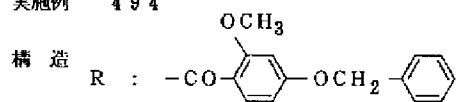
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【1004】

【表299】

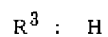
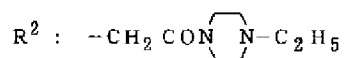
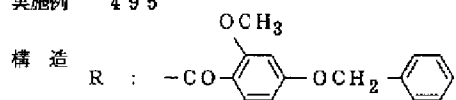
実施例 494



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 495



結晶形 : 無色不定形

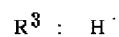
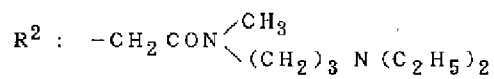
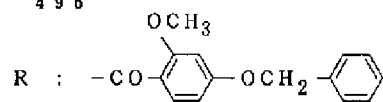
形態 : HCl

【1005】

【表300】

實施例 496

構造

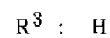
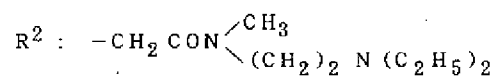
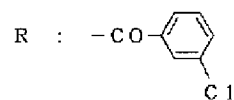


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 497

構造



結晶形 : 無色不定形

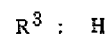
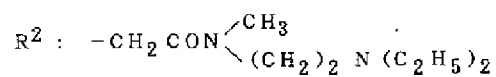
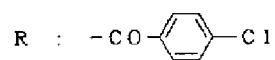
形態 : HCl

【1006】

【表301】

實施例 498

構造

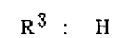
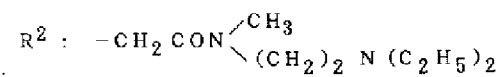
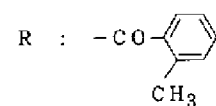


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 499

構造



結晶形 : 淡黃色不定形

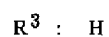
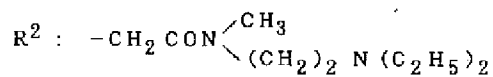
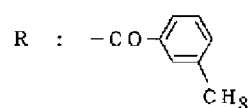
形態 : HCl

【1007】

【表302】

実施例 500

構造

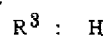
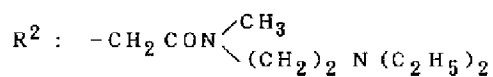
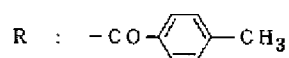


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 501

構造



結晶形 : 無色不定形

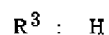
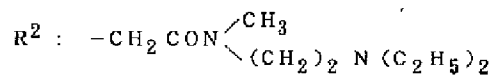
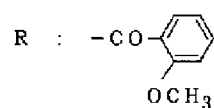
形態 : HCl

【1008】

【表303】

実施例 502

構造

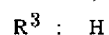
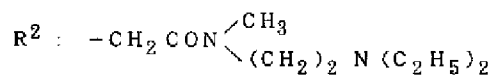
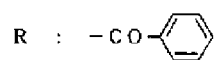


結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

実施例 503

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

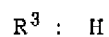
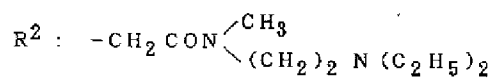
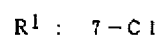
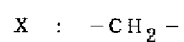
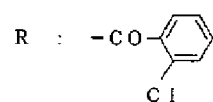
形態 : 遊離

【1009】

【表304】

实施例 504

構造

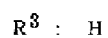
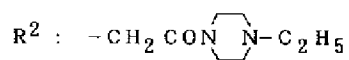
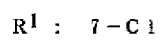
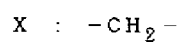
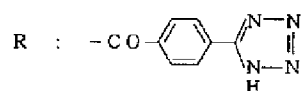


結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

实施例 505

構造



結晶形 : 淡褐色粉末状

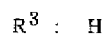
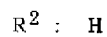
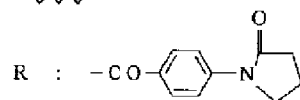
形態 : 遊離

【1010】

【表305】

実施例 506

構造



結晶形 : 白色粉末状

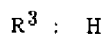
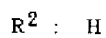
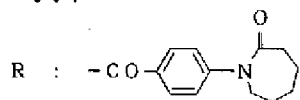
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 209-211℃

形態 : 遊離

実施例 507

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 169-170℃

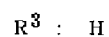
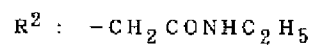
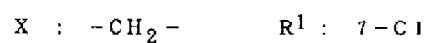
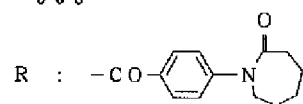
形態 : 遊離

【1011】

【表306】

實施例 508

構造

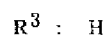
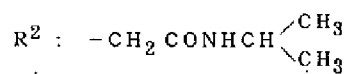
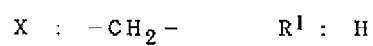
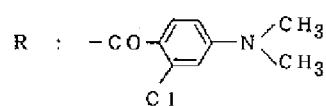


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 509

構造



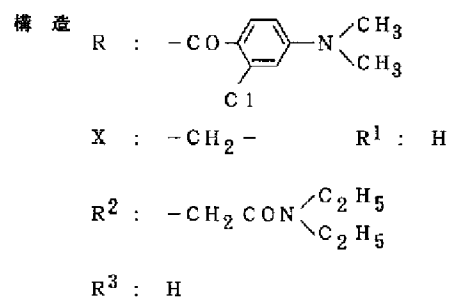
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1012】

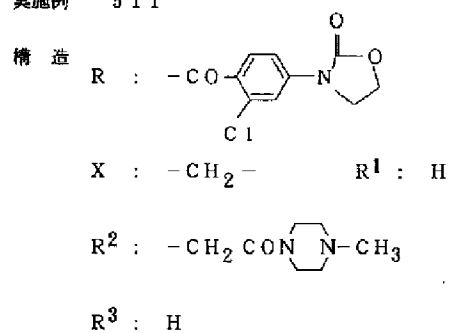
【表307】

實施例 510



結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 511

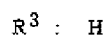
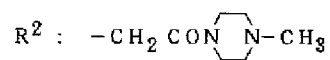
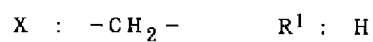
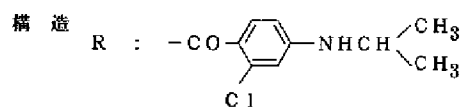


結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

【1013】

【表308】

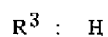
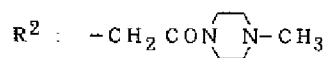
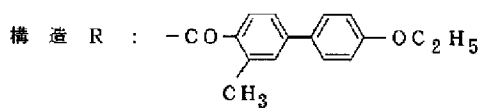
実施例 512



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 513



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

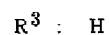
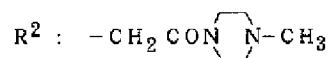
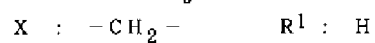
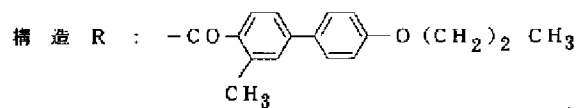
融点 : 204-207℃

形態 : HCl

【1014】

【表309】

実施例 514



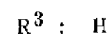
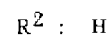
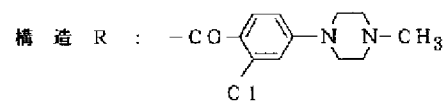
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 217-220℃

形態 : HCl

実施例 515



結晶形 : 黄色針状

再結晶溶媒 : 水

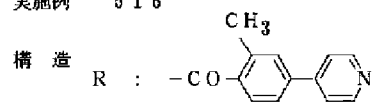
融点 : 198-202℃ (分解)

形態 : HI

【1015】

【表310】

実施例 516



$X : -\text{CH}_2-$ $R^1 : 7-\text{Cl}$

$R^2 : \text{H}$

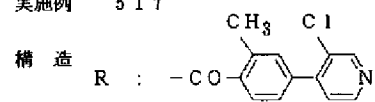
$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 517



$X : -\text{CH}_2-$ $R^1 : 7-\text{Cl}$

$R^2 : \text{H}$

$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

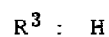
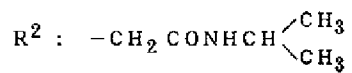
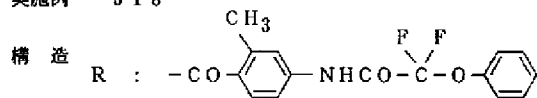
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

【1016】

【表311】

実施例 518



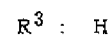
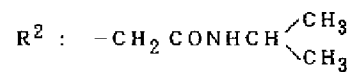
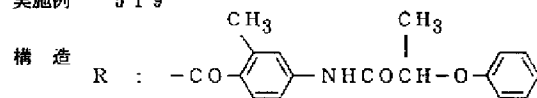
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 154-155℃

形態 : 遊離

実施例 519



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

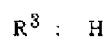
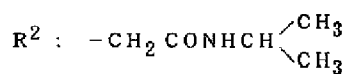
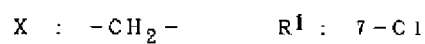
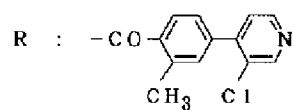
融点 : 188-190℃

【1017】

【表312】

実施例 520

構造

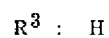
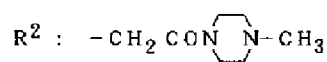
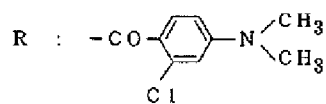


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 521

構造



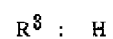
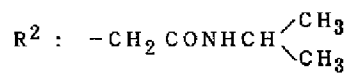
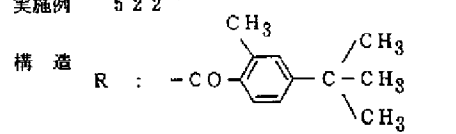
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【1018】

【表313】

実施例 522

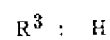
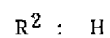
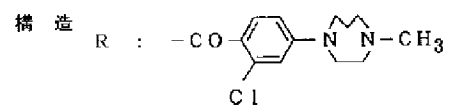


結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融 点 : 149-151℃

実施例 523



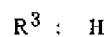
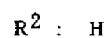
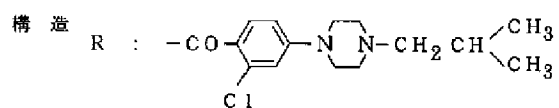
結 晶 形 : 黄色不定形

形 態 : 遊 離

【1019】

【表314】

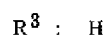
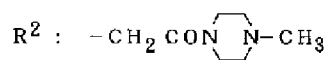
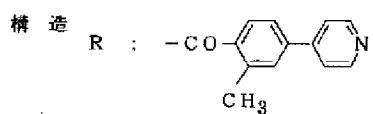
実施例 524



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 525



結晶形 : 無色不定形

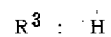
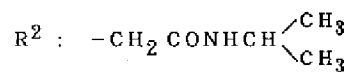
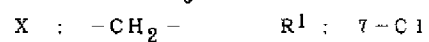
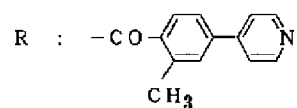
形態 : HCl

【1020】

【表315】

実施例 526

構造

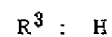
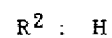
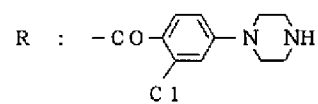


結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 527

構造



結晶形 : 褐色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

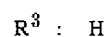
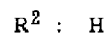
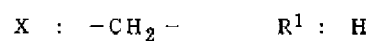
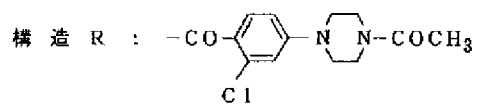
融点 : 155-159℃ (分解)

形態 : HCl

【1021】

【表316】

実施例 528



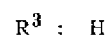
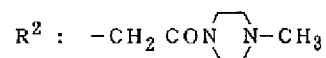
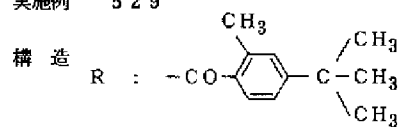
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 142-145℃

形態 : 遊離

実施例 529



結晶形 : 無色不定形

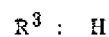
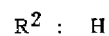
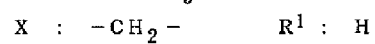
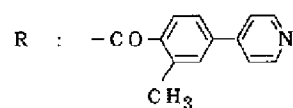
形態 : HCl

【1022】

【表317】

実施例 530

構造



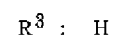
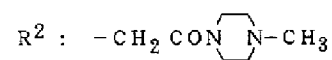
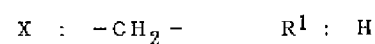
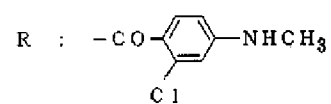
結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル-n-ヘキサン

形態 : 遊離

実施例 531

構造



結晶形 : 無色不定形

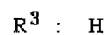
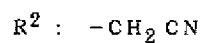
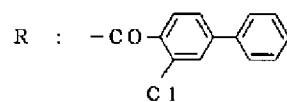
形態 : 2HCl

【1023】

【表318】

実施例 532

構造

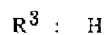
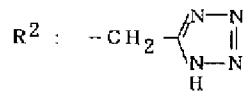
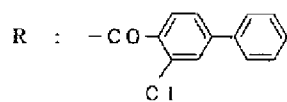


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 533

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 191-194℃

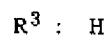
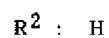
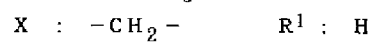
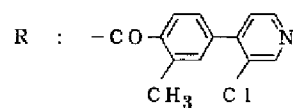
形態 : 遊離

【1024】

【表319】

實施例 534

構造

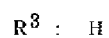
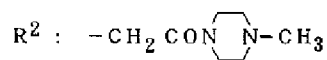
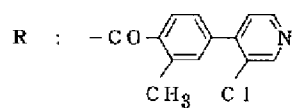


結晶形 : 淡褐色不定形

形態 : 遊離

實施例 535

構造



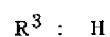
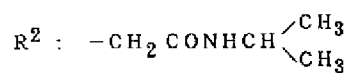
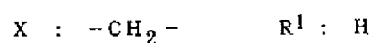
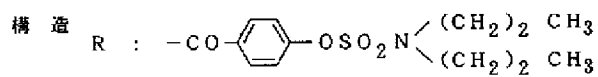
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【1025】

【表320】

実施例 536

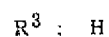
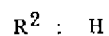
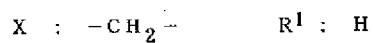
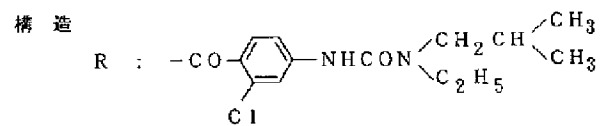


結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 146-147℃

実施例 537



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

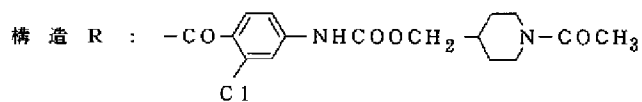
融点 : 201-202℃

形態 : 遊離

【1026】

【表321】

実施例 538



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

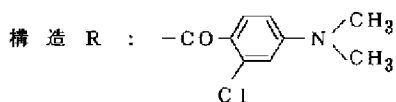
R^3 : H

結 晶 形 : 白色粉末状

融 点 : 118-120℃

形 態 : 遊 離

実施例 539



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジイソプロピルエーテル

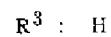
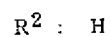
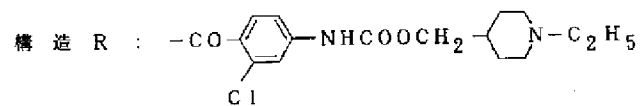
融 点 : 173-174.5℃

形 態 : 遊 離

【1027】

【表322】

実施例 540



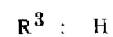
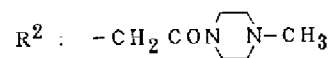
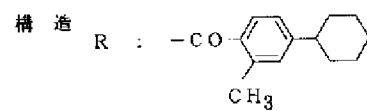
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗淨

融点 : 159-161℃

形態 : 遊離

実施例 541



結晶形 : 無色不定形

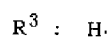
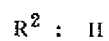
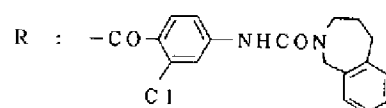
形態 : HCl

【1028】

【表323】

実施例 542

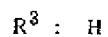
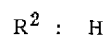
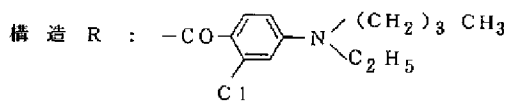
構造



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 543



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン

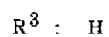
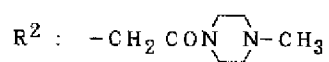
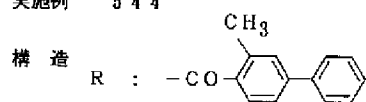
融点 : 94-95℃

形態 : 遊離

【1029】

【表324】

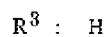
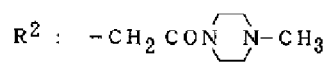
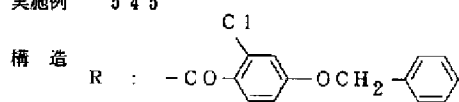
実施例 544



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 545



結晶形 : 無色不定形

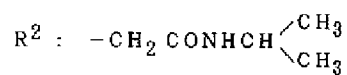
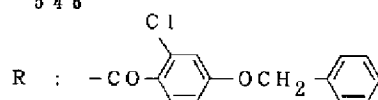
形態 : HCl

【1030】

【表325】

実施例 546

構造



結晶形 : 白色粉末状

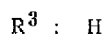
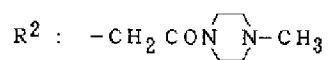
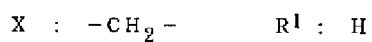
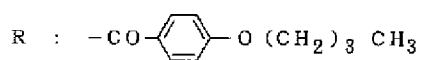
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 174-176°C

形態 : 遊離

実施例 547

構造



結晶形 : 無色不定形

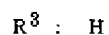
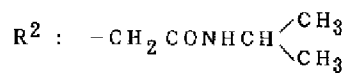
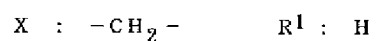
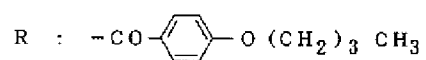
形態 : HCl

【1031】

【表326】

実施例 548

構造



結晶形 : 白色粉末状

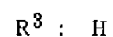
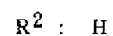
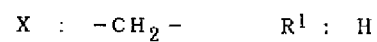
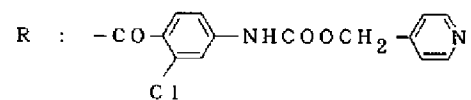
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 133-135℃

形態 : 遊離

実施例 549

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル洗浄

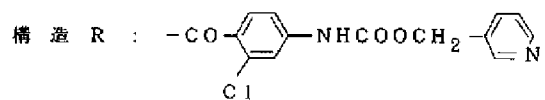
融点 : 181-184℃

形態 : 遊離

【1032】

【表327】

実施例 550



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

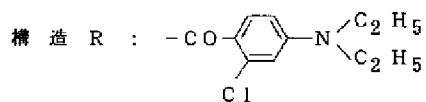
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル洗浄

融点 : $197-200^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 551



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

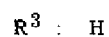
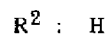
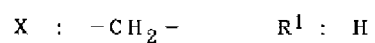
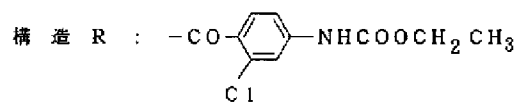
融点 : $162-163.5^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

【1033】

【表328】

実施例 552



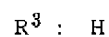
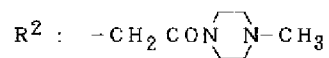
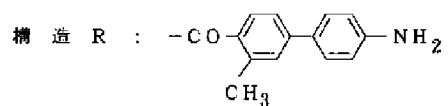
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノールで洗浄

融点 : $168-171^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 553



結晶形 : 無色不定形

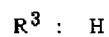
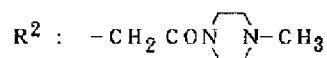
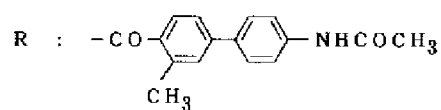
形態 : 遊離

【1034】

【表329】

實施例 554

構造

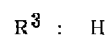
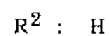
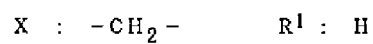
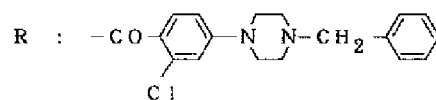


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 555

構造



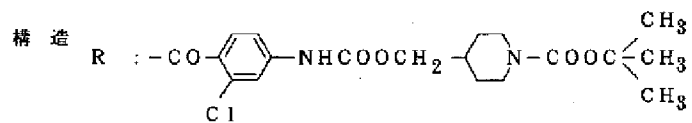
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1035】

【表330】

実施例 556



$X : -\text{CH}_2-$ $R^1 : \text{H}$

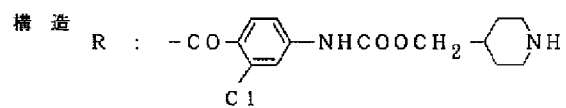
$R^2 : \text{H}$

$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 557



$X : -\text{CH}_2-$ $R^1 : \text{H}$

$R^2 : \text{H}$

$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

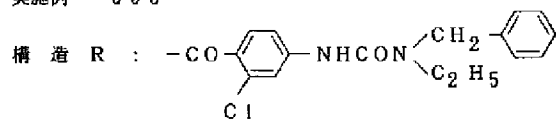
融点 : $150-152^\circ\text{C}$

形態 : CF_3COOH

【1036】

【表331】

実施例 558



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

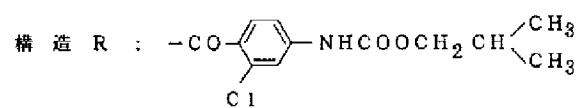
R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 559



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{CON} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \text{N-CH}_3 \end{array}$

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

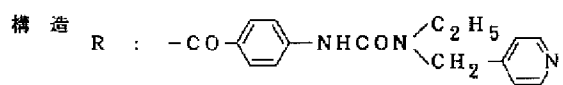
再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル

形態 : 遊離

【1037】

【表332】

実施例 560



X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : H

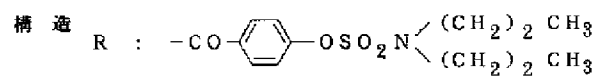
R² : H

R³ : H

結晶形 : 微橙色不定形

形態 : HCl

実施例 561



X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 186-188℃

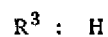
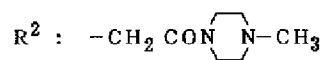
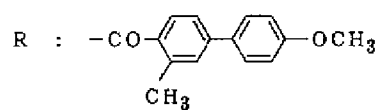
形態 : 遊離

【1038】

【表333】

实施例 562

構造

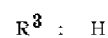
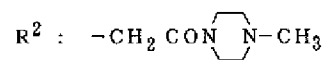
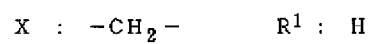
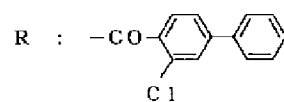


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

实施例 563

構造



結晶形 : 無色不定形

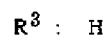
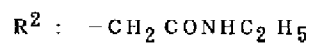
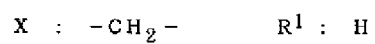
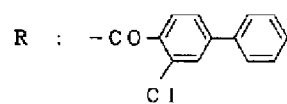
形態 : HCl

【1039】

【表334】

實施例 564

構造

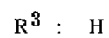
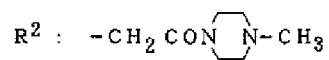
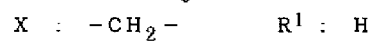
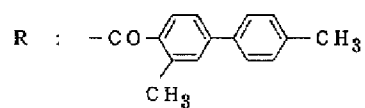


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 565

構造



結晶形 : 無色不定形

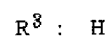
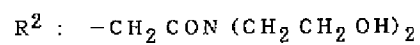
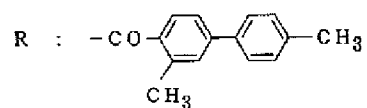
形態 : HCl

【1040】

【表335】

実施例 566

構造

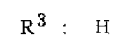
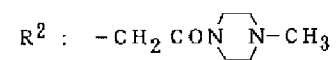
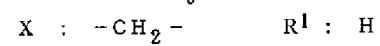
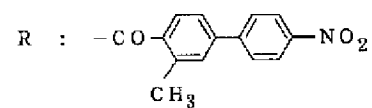


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 567

構造



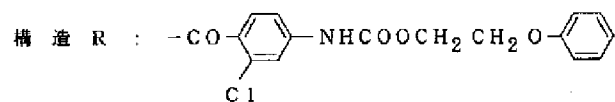
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【1041】

【表336】

実施例 568



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

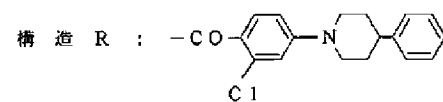
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $144-146^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 569



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

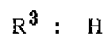
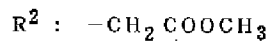
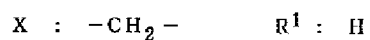
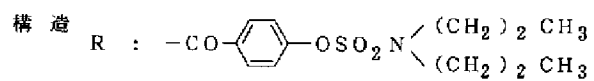
融点 : $128-130^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

【1042】

【表337】

実施例 570



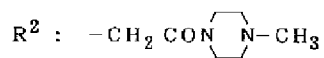
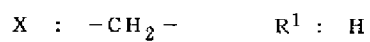
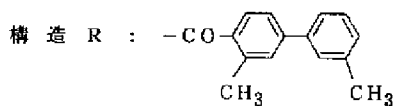
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 110-111℃

形態 : 遊離

実施例 571



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : アセトン-ジエチルエーテル

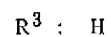
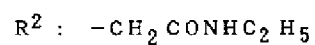
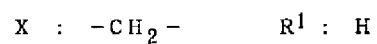
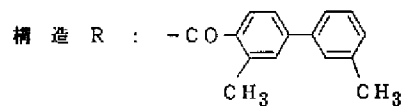
融点 : 161.5-163℃

形態 : HCl

【1043】

【表338】

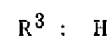
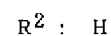
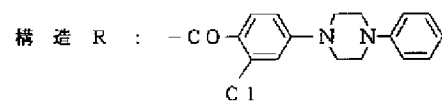
実施例 572



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 573



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル

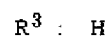
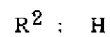
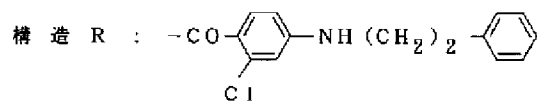
融点 : $150 \sim 162^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

【1044】

【表339】

実施例 574



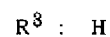
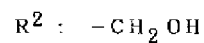
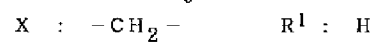
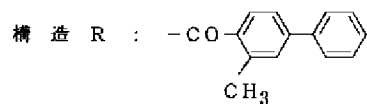
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-酢酸エチル-n-ヘキサン

融 点 : 108-109℃

形 態 : 遊 離

実施例 575



結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

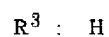
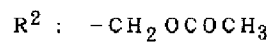
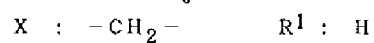
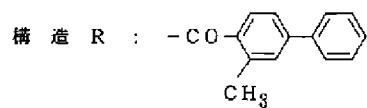
融 点 : 104-106℃

形 態 : 遊 離

【1045】

【表340】

実施例 576



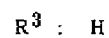
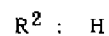
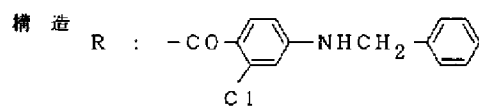
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 115-116℃

形態 : 遊離

実施例 577



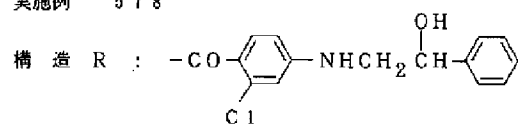
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1046】

【表341】

実施例 578



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

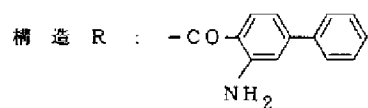
R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 579



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサノール酢酸エチル

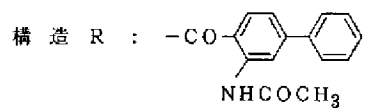
融点 : 201.5-203℃

形態 : 遊離

【1047】

【表342】

実施例 580



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

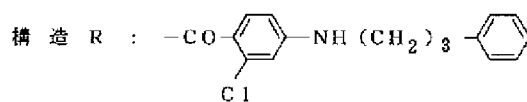
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融点 : 196-198℃

形態 : 遊離

実施例 581



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン

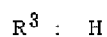
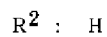
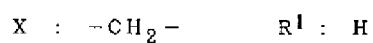
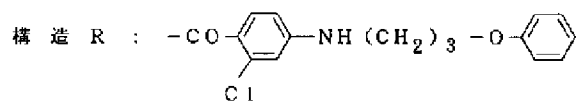
融点 : 130-133℃

形態 : 遊離

【1048】

【表343】

実施例 582



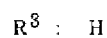
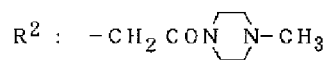
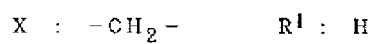
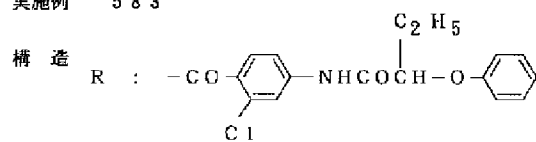
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 125-127°C

形態 : 遊離

実施例 583



結晶形 : 無色不定形

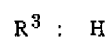
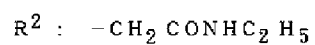
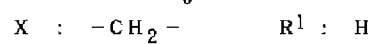
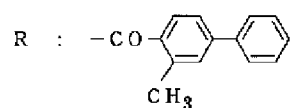
形態 : HCl

【1049】

【表344】

実施例 584

構造

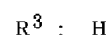
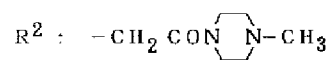
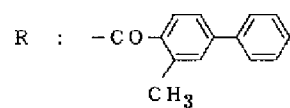


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 585

構造



結晶形 : 無色不定形

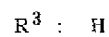
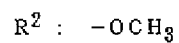
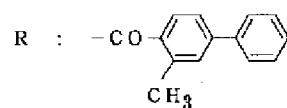
形態 : 遊離

【1050】

【表345】

実施例 586

構造

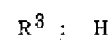
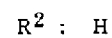
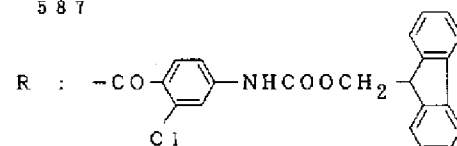


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 587

構造



結晶形 : 白色粉末状

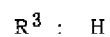
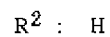
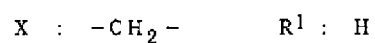
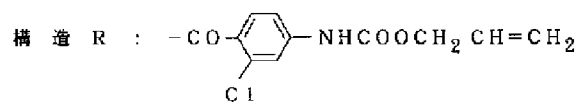
融点 : 196-198℃

形態 : 遊離

【1051】

【表346】

実施例 588



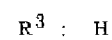
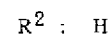
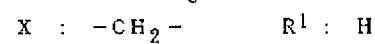
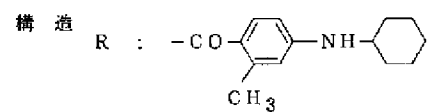
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

融点 : $169-170^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 589



結晶形 : 微黄色不定形

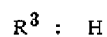
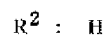
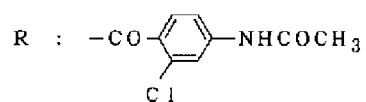
形態 : 遊離

【1052】

【表347】

実施例 590

構造



結晶形 : 白色粉末状

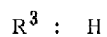
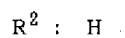
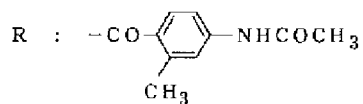
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 218-220℃

形態 : 遊離

実施例 591

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

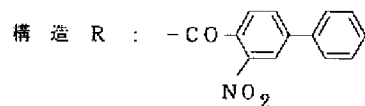
融点 : 194-195℃

形態 : 遊離

【1053】

【表348】

実施例 592



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : H

R^3 : H

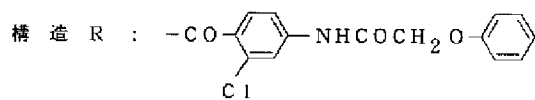
結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融点 : 158-159℃

形態 : 遊離

実施例 593



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{OCH}_3$

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

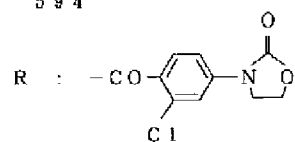
形態 : 遊離

【1054】

【表349】

實施例 594

構造



X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : H

R² : H

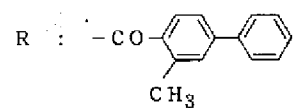
R³ : H

結晶形 : 白色粉末狀

形態 : 遊離

實施例 595

構造



X : $\text{---CH}_2\text{---}$ R¹ : H

R² : $\text{---N(C}_2\text{H}_5)_2$

R³ : H

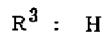
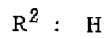
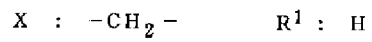
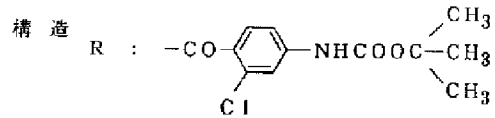
結晶形 : 黃色不定形

形態 : 遊離

【1055】

【表350】

実施例 596



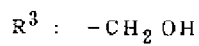
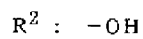
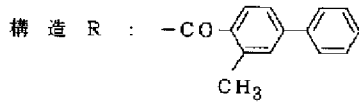
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル

融点 : 205-206℃

形態 : 遊離

実施例 597



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

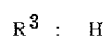
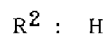
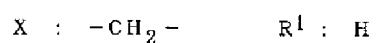
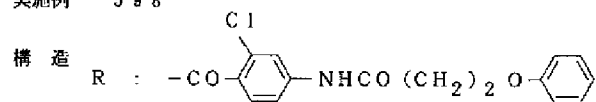
融点 : 142-144℃

形態 : 遊離

【1056】

【表351】

実施例 598



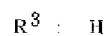
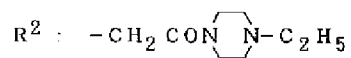
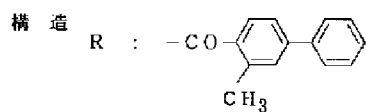
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 132-135℃

形態 : 遊離

実施例 599



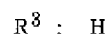
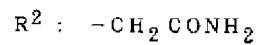
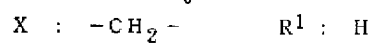
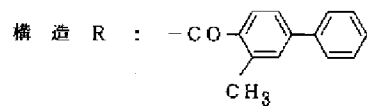
結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : HCl

【1057】

【表352】

実施例 600



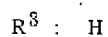
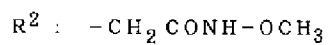
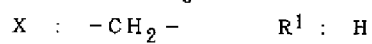
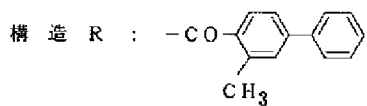
結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $119-121^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 601



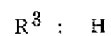
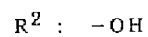
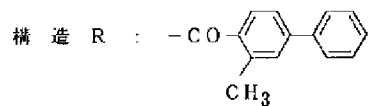
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1058】

【表353】

実施例 602



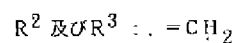
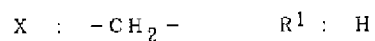
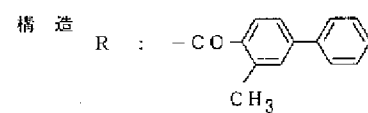
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $175-178^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 603



結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジイソプロピルエーテル-n-ヘキサン

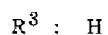
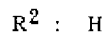
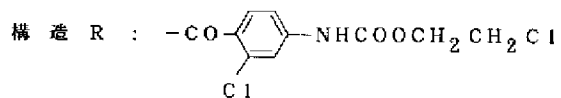
融点 : $113-115^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

【1059】

【表354】

実施例 604



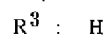
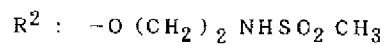
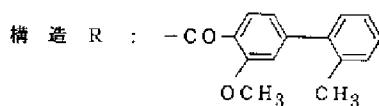
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール洗淨

融 点 : $128-130^\circ\text{C}$

形 態 : 遊 離

実施例 605



結 晶 形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融 点 : $182-183^\circ\text{C}$

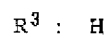
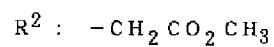
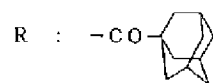
形 態 : 遊 離

【1060】

【表355】

實施例 606

構造

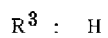
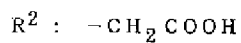
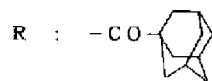


結晶形 : 無色油狀

形態 : 遊離

實施例 607

構造



結晶形 : 無色不定形

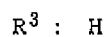
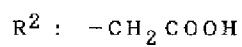
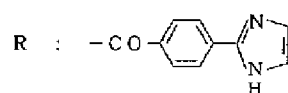
形態 : 遊離

【1061】

【表356】

实施例 608

構造

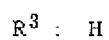
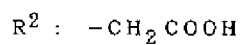
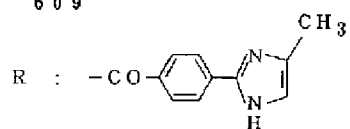


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

实施例 609

構造



結晶形 : 黄色不定形

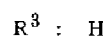
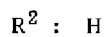
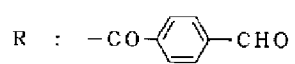
形態 : 遊離

【1062】

【表357】

实施例 610

構造

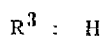
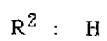
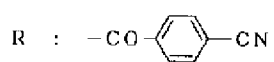


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

实施例 611

構造



結晶形 : 褐色不定形

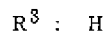
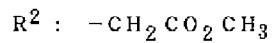
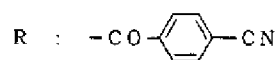
形態 : 遊離

【1063】

【表358】

実施例 612

構造



結晶形 : 淡褐色粉末状

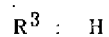
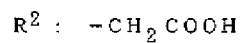
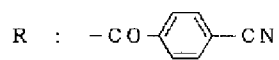
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 149~151℃

形態 : 遊離

実施例 613

構造



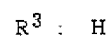
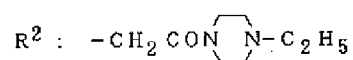
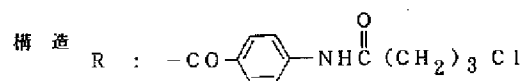
結晶形 : 淡褐色不定形

形態 : 遊離

【1064】

【表359】

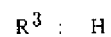
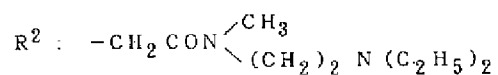
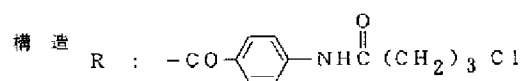
实施例 614



形態 : 遊離

結晶形 : 淡黄色不定形

实施例 615



形態 : 遊離

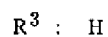
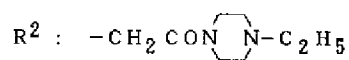
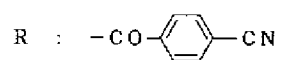
結晶形 : 無色油状

【1065】

【表360】

实施例 616

構造

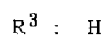
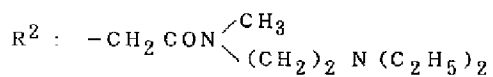
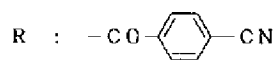


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 617

構造



結晶形 : 淡褐色油状

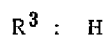
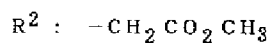
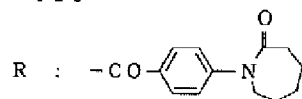
形態 : 遊離

【1066】

【表361】

实施例 618

構造

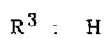
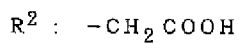
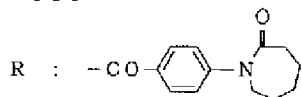


結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

实施例 619

構造



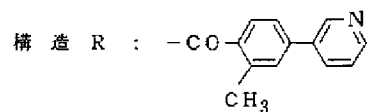
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1067】

【表362】

実施例 620



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl

R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

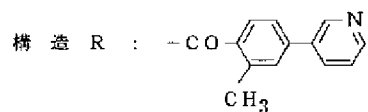
R^3 : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : 151-161℃

実施例 621



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジエチルエーテル

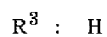
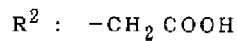
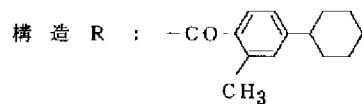
融点 : 258-260℃

形態 : HCl

【1068】

【表363】

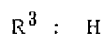
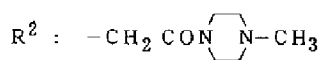
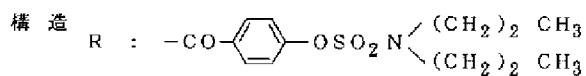
實施例 622



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 623



結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

【1069】

【表364】

実施例 624

構造 R : $-\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 625

構造 R : $-\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$

X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : $188-189^\circ\text{C}$

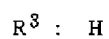
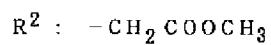
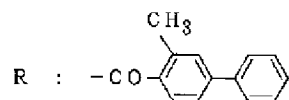
形態 : 遊離

【1070】

【表365】

實施例 626

構造

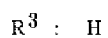
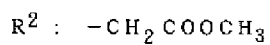
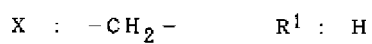
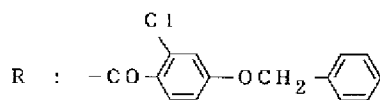


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 627

構造



結晶形 : 無色不定形

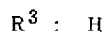
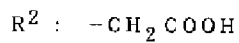
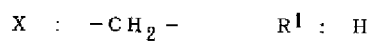
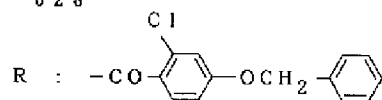
形態 : 遊離

【1071】

【表366】

実施例 628

構造



結晶形 : 白色粉末状

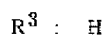
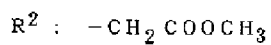
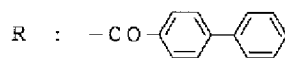
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 178-179℃

形態 : 遊離

実施例 629

構造



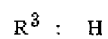
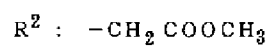
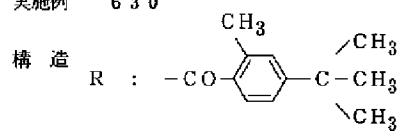
結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

【1072】

【表367】

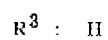
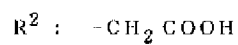
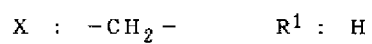
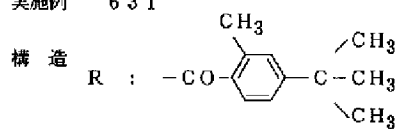
实施例 630



結晶形 : 無色油状

形態 : 遊離

实施例 631



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

【1073】

【表368】

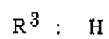
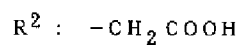
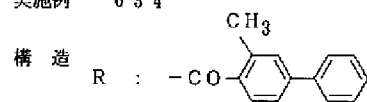
实施例	632
構造	$R : -CO-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)-\text{OC}_2\text{H}_5$
	$X : -\text{CH}_2- \quad R^1 : 7-\text{Cl}$
	$R^2 : -\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$
	$R^3 : \text{H}$
結晶形	無色不定形
形態	遊離

实施例	633
構造	$R : -CO-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)-\text{OC}_2\text{H}_5$
	$X : -\text{CH}_2- \quad R^1 : 7-\text{Cl}$
	$R^2 : -\text{CH}_2\text{COOH}$
	$R^3 : \text{H}$
結晶形	無色不定形
形態	遊離

【1074】

【表369】

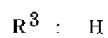
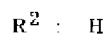
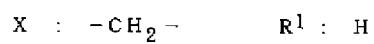
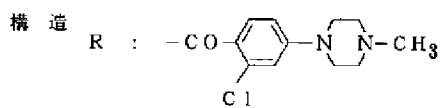
实施例 634



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 635



結晶形 : 白色粉末状

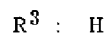
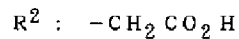
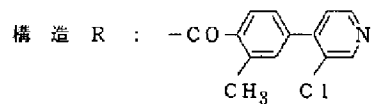
融点 : 138-140℃

形態 : 遊離

【1075】

【表370】

実施例 636



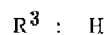
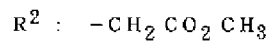
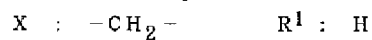
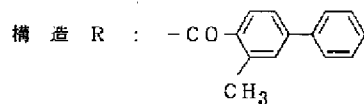
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 208-211℃

形態 : 遊離

実施例 637



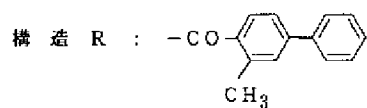
結晶形 : 淡褐色油状

形態 : 遊離

【1076】

【表371】

実施例 638



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

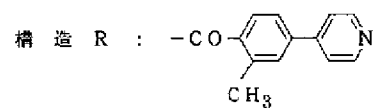
結晶形 : 淡褐色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

融点 : $192-194^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 639



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : $238-239^\circ\text{C}$

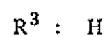
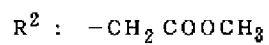
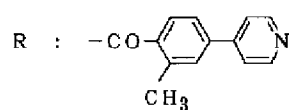
形態 : HCl

【1077】

【表372】

实施例 640

構造

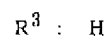
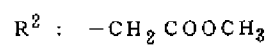
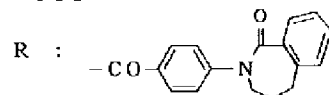


結晶形 : 淡黄色固体

形態 : 遊離

实施例 641

構造



結晶形 : 白色粉末状

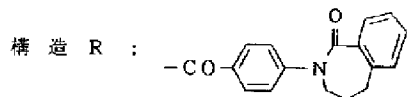
融点 : 82 ~ 87℃

形態 : 遊離

【1078】

【表373】

实施例 642



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : 7-Cl

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

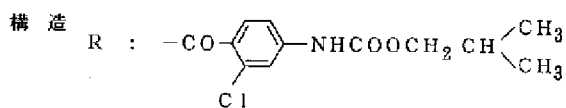
R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

融点 : 121-127℃

形態 : 遊離

实施例 643



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R^3 : H

結晶形 : 無色不定形

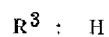
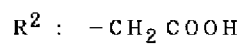
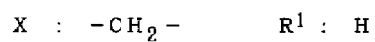
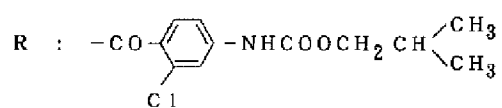
形態 : 遊離

【1079】

【表374】

実施例 644

構造

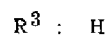
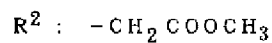
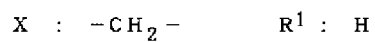
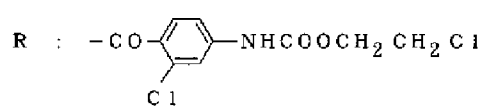


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 645

構造



結晶形 : 白色粉末状

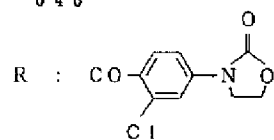
形態 : 遊離

【1080】

【表375】

実施例 646

構造



$X : -\text{CH}_2-$ $R^1 : \text{H}$

$R^2 : -\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

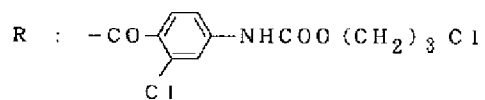
$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 647

構造



$X : -\text{CH}_2-$ $R^1 : \text{H}$

$R^2 : -\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 無色不定形

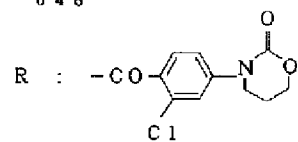
形態 : 遊離

【1081】

【表376】

实施例 648

構造



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

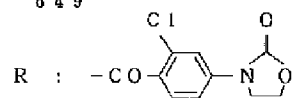
R^3 : H

結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

实施例 649

構造



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

結晶形 : 白色粉末状

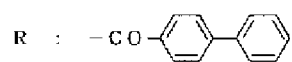
形態 : 遊離

【1082】

【表377】

実施例 650

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

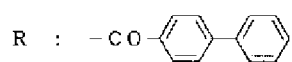
R² 及び R³ : =O

結晶形 : 微黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 651

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² 及び R³ : =CH-CO₂C₂H₅

結晶形 : 微黄色不定形

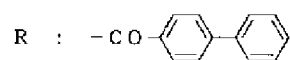
形態 : 遊離

【1083】

【表378】

実施例 652

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂CO₂C₂H₅

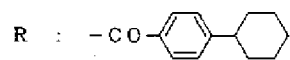
R³ : H

結晶形 : 微黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 653

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² 及び R³ : =O

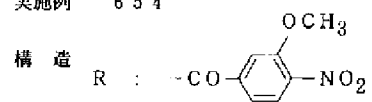
結晶形 : 黄色固体

形態 : 遊離

【1084】

【表379】

実施例 654



$X : \text{単結合}$

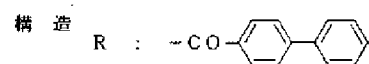
$R^1 : 6-Cl$

$R^2 \text{ 及び } R^3 : =O$

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 655



$X : \text{単結合}$

$R^1 : 6-Cl$

$R^2 : -CH_2CO_2H$

$R^3 : H$

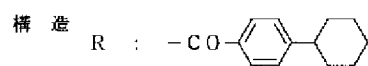
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1085】

【表380】

実施例 656



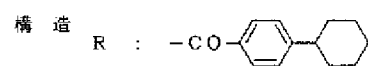
X : 単結合 R¹ : 6-Cl

R² 及び R³ : =CH-COOC₂H₅

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 657



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

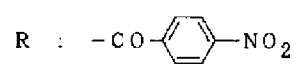
形態 : 遊離

【1086】

【表381】

実施例 658

構造



X : 単結合

R¹ : 6-C1

R² : -CH₂CO₂CH₃

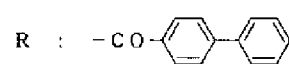
R³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 659

構造



X : 単結合

R¹ : 6-C1

R² : -CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

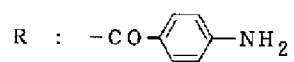
形態 : 遊離

【1087】

【表382】

実施例 660

構造



X : 単結合

R^I : 6-Cl

R² : -CH₂CO₂CH₃

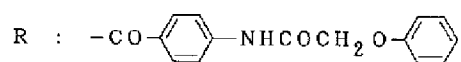
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 661

構造



X : 単結合

R^I : 6-Cl

R² : -CH₂CO₂CH₃

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

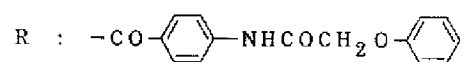
形態 : 遊離

【1088】

【表383】

実施例 662

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂COOH

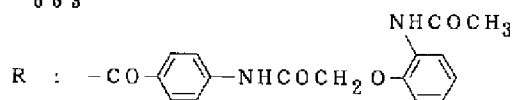
R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 663

構造



X : 単結合

R¹ : 5-Cl

R² : -CH₂CO₂CH₃

R³ : H

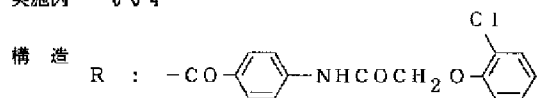
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1089】

【表384】

実施例 664



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

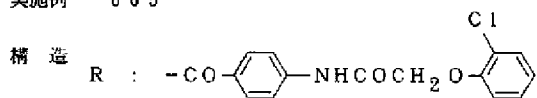
R² : -CH₂CO₂CH₃

R³ : H

結晶形 : 赤色不定形

形態 : 遊離

実施例 665



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

R² : -CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 黄色不定形

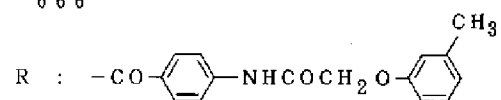
形態 : 遊離

【1090】

【表385】

実施例 666

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

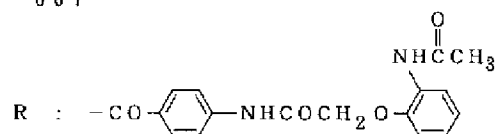
R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 667

構造



X : 単結合

R¹ : 6-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

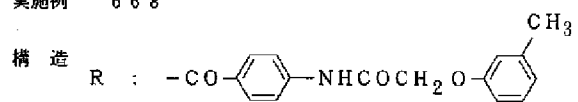
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1091】

【表386】

実施例 668



X : 単結合 R¹ : 6-Cl

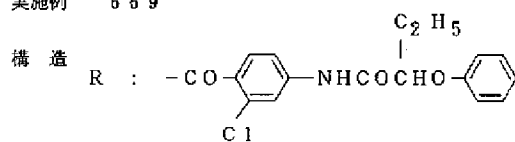
R² : -CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 669



X : -CH₂- R¹ : H

R² : -CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

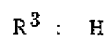
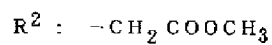
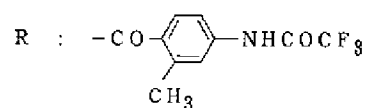
形態 : 遊離

【1092】

【表387】

實施例 670

構造

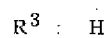
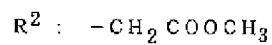
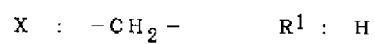
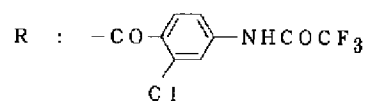


結晶形 : 微赤色粉末狀

形態 : 遊離

實施例 671

構造



結晶形 : 白色粉末狀

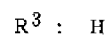
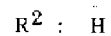
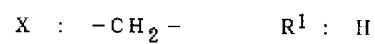
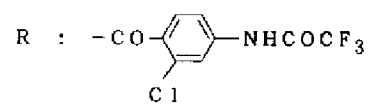
形態 : 遊離

【1093】

【表388】

實施例 672

構造

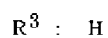
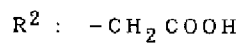
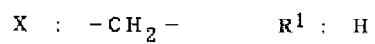
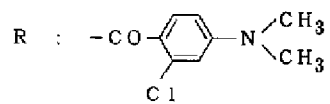


結晶形 : 微赤色粉末狀

形態 : 遊離

實施例 673

構造



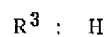
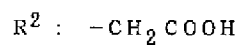
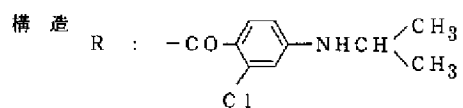
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1094】

【表389】

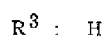
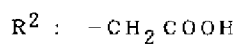
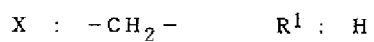
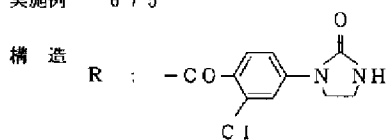
實施例 674



結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 675



結晶形 : 無色不定形

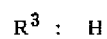
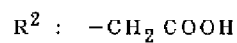
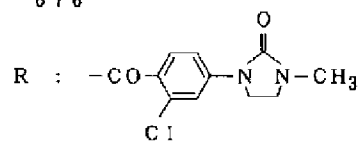
形態 : 遊離

【1095】

【表390】

实施例 676

構造

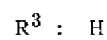
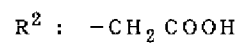
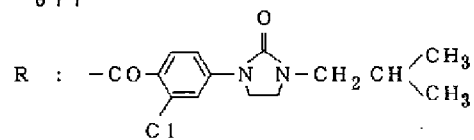


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

实施例 677

構造



結晶形 : 無色不定形

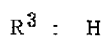
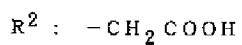
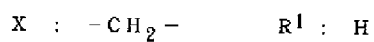
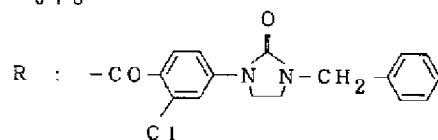
形態 : 遊離

【1096】

【表391】

実施例 678

構造

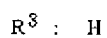
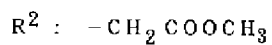
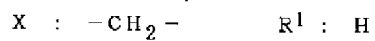
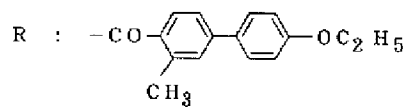


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 679

構造



結晶形 : 無色不定形

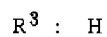
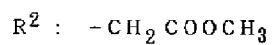
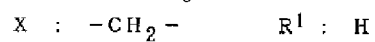
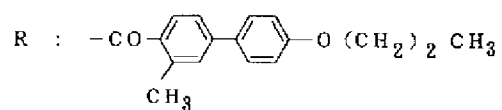
形態 : 遊離

【1097】

【表392】

実施例 680

構造

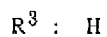
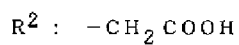
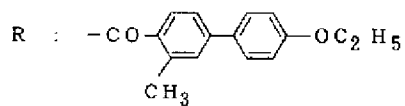


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 681

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

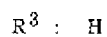
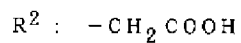
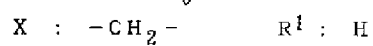
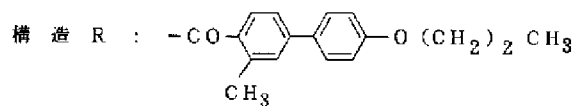
融点 : 183-183.5℃

形態 : 遊離

【1098】

【表393】

実施例 682



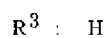
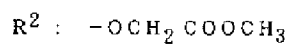
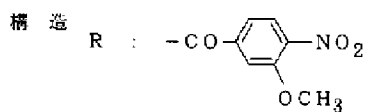
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : 169.5-170℃

形態 : 遊離

実施例 683



結晶形 : 微黄色粉末状

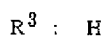
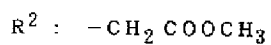
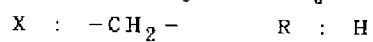
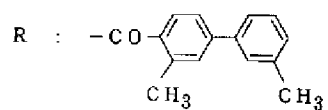
形態 : 遊離

【1099】

【表394】

実施例 684

構造

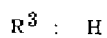
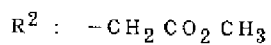
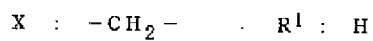
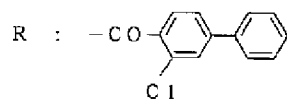


結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 685

構造



結晶形 : 無色不定形

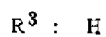
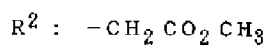
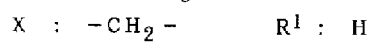
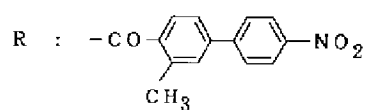
形態 : 遊離

【1100】

【表395】

实施例 686

構造

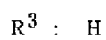
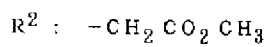
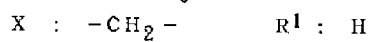
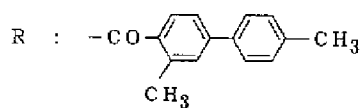


結晶形 : 微黄色粉末状

形態 : 遊離

实施例 687

構造



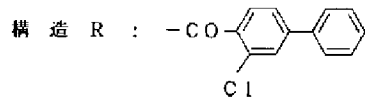
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1101】

【表396】

実施例 688



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

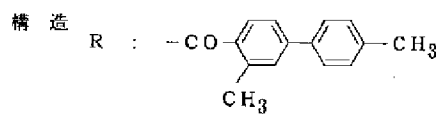
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール-ジエチルエーテル

融点 : $176-177^\circ\text{C}$

形態 : 遊離

実施例 689



X : $-\text{CH}_2-$ R^1 : H

R^2 : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R^3 : H

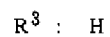
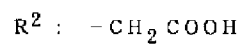
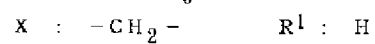
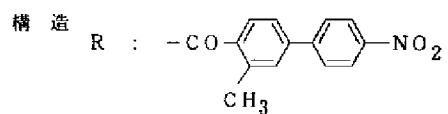
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1102】

【表397】

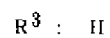
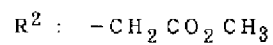
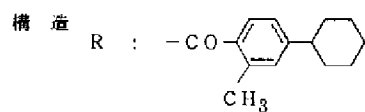
実施例 690



結 晶 形 : 微黄色粉末状

形 態 : 遊 離

実施例 691

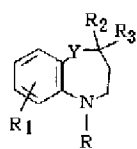


結 晶 形 : 無色不定形

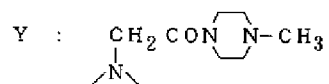
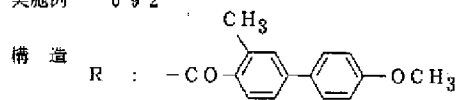
形 態 : 遊 離

【1103】 適当な出発原料を用い、実施例1及び2と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【1104】
【表398】



実施例 692



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形

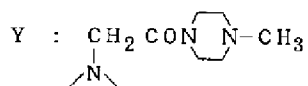
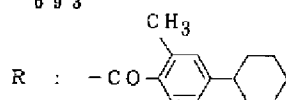
形態 : 遊離

【1105】

【表399】

実施例 693

構造



R¹ : H

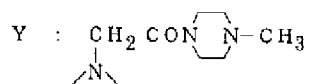
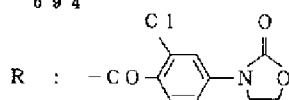
R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 694

構造



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

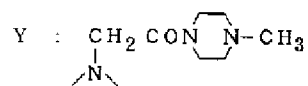
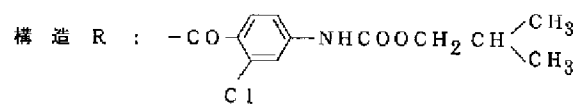
融点 : 166-170℃

形態 : 遊離

【1106】

【表400】

実施例 695



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

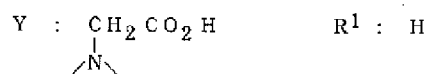
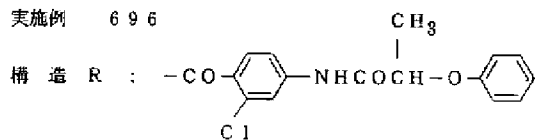
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 215-218℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 696



R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

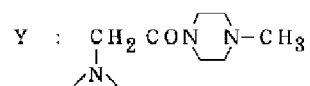
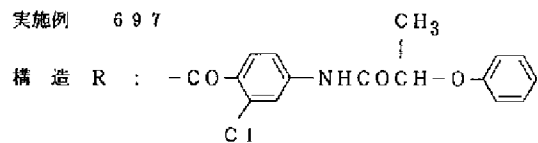
融点 : 182-188℃ (分解)

形態 : 遊離

【1107】

【表401】

実施例 697



R¹ : H

R² : H

R³ : H

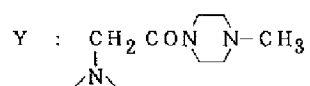
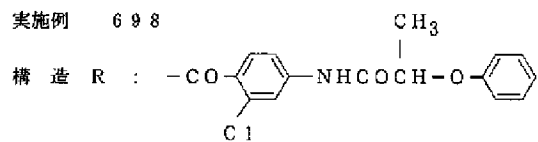
結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 105-108℃

形態 : 遊離

実施例 698



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

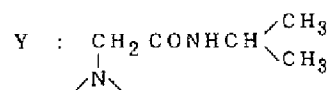
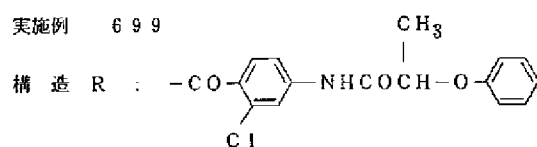
融点 : 154-158℃

形態 : 遊離

【1108】

【表402】

実施例 699



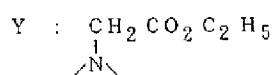
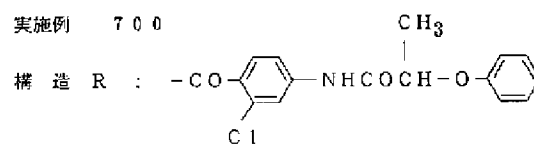
R¹ : H R² : H R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 144-145℃

実施例 700



R¹ : H R² : H R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

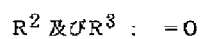
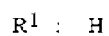
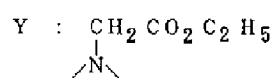
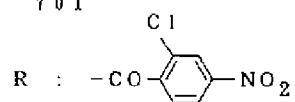
形態 : 遊離

【1109】

【表403】

実施例 701

構造

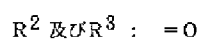
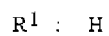
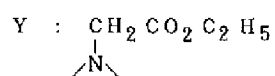
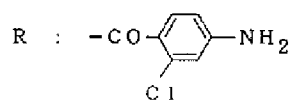


結晶形 : 褐色粉末状

形態 : 遊離

実施例 702

構造



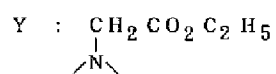
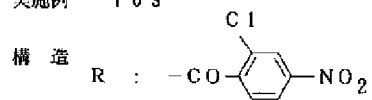
結晶形 : 無色粉末状

形態 : 遊離

【1110】

【表404】

実施例 703



R¹ : H

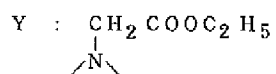
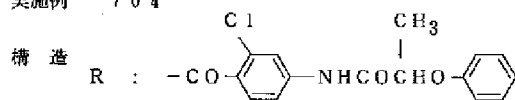
R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

実施例 704



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

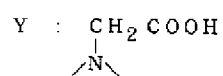
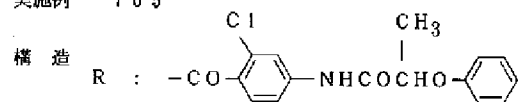
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1111】

【表405】

實施例 705



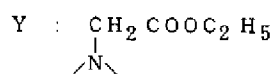
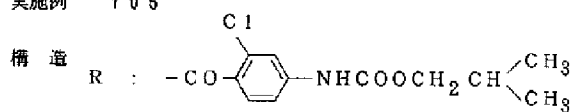
R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 706



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

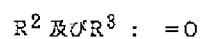
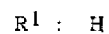
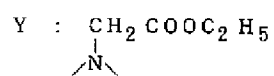
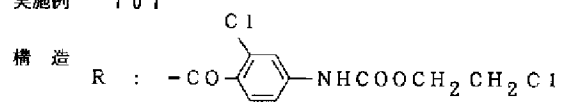
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1112】

【表406】

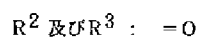
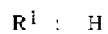
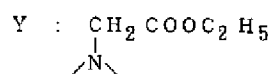
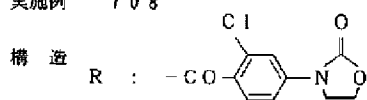
实施例 707



結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

实施例 708



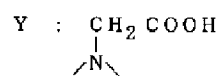
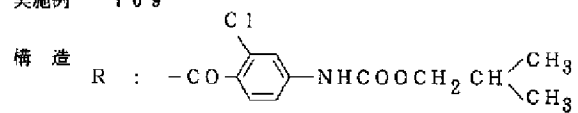
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1113】

【表407】

実施例 709



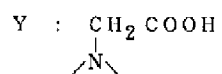
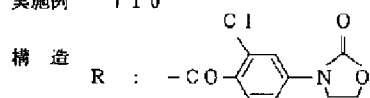
R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 710



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 黄色不定形

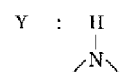
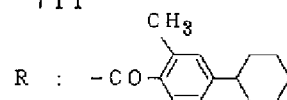
形態 : 遊離

【1114】

【表408】

実施例 711

構造



R¹ : H

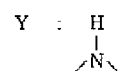
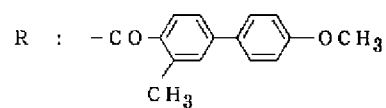
R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 712

構造



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

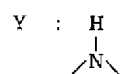
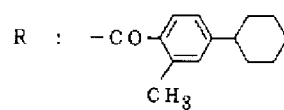
形態 : 遊離

【1115】

【表409】

実施例 713

構造



R¹ : H

R² : H

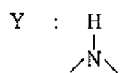
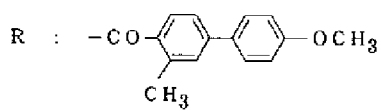
R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 714

構造



R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色プリズム状

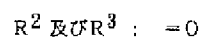
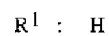
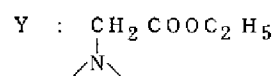
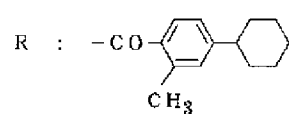
形態 : 遊離

【1116】

【表410】

実施例 715

構造

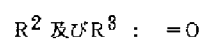
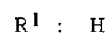
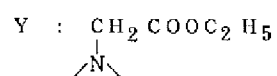
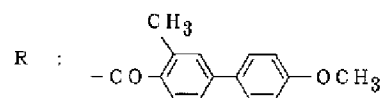


結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 716

構造



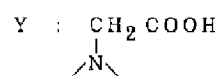
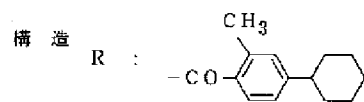
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

【1117】

【表411】

実施例 717



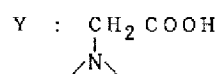
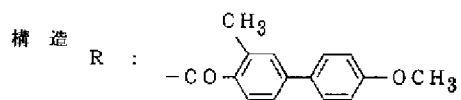
R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 718



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

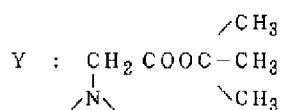
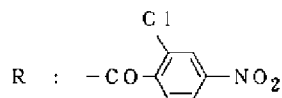
形態 : 遊離

【1118】

【表412】

実施例 719

構造



$R^1 : \text{H}$

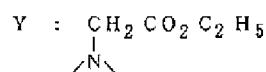
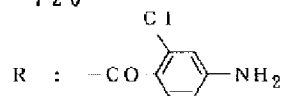
R^2 及び $R^3 : =\text{O}$

結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 720

構造



$R^1 : \text{H}$

$R^2 : \text{H}$

$R^3 : \text{H}$

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 120-123℃

形態 : 遊離

【1119】上記で得られる各実施例化合物のNMRスペクトルは、次の通りである。

【1120】実施例147の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm :

1.35-3.55及び4.50-5.10 [全16H, m, 2.20 (s), 2.39 (s), 4.69 (s)], 6.54 (1H, d, $J=8.27\text{Hz}$), 6.71 (1H, d, $J=12.82\text{Hz}$), 6.78-6.95 (1H, m), 7.05-7.50及び7.75-8.20 (全3H, m)。

【1121】実施例148の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm :

0.98-3.94, 4.41-4.61及び5.03-5.19 [全24H, m, 1.12 (t, $J=6.67\text{Hz}$), 4.57 (s)], 6.38-7.52及び8.16-8.38 (全13H, m)。

【1122】実施例150の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm :

0.86-3.91, 4.36-4.61及び5.00

-5.20 [全27H, m, 1.12 (t, $J=7.08\text{Hz}$), 2.34 (s), 4.54 (s)], 7.39-7.53及び8.14-8.42 (全12H, m)。

【1123】実施例151の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm :

0.90-4.24, 4.52-4.81及び5.08-5.24 [全27H, m, 1.25 (t, $J=7.27$), 2.60 (s), 4.67 (s), 4.76 (s)], 6.48-7.71及び8.25-8.62 (全12H, m)。

【1124】実施例152の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm :

0.93-4.18, 4.35-4.69及び5.00-5.21 [全27H, m, 1.12 (t, $J=6.62\text{Hz}$), 2.30 (s), 4.53 (s)], 6.48-7.62及び8.18-8.40 (全12H, m)。

【1125】実施例153の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.90-4.18, 4.35-4.70及び5.05-5.18 [全27H, m, 3.89 (s), 4.59 (s)], 6.45-8.12及び8.90-9.25 (全12H, m)。

【1126】実施例154の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.95-3.91, 4.31-4.68及び4.98-5.20 [全27H, m, 1.12 (t, $J=7.2$ Hz), 3.80 (s), 4.53 (s)], 6.48-7.61及び8.29-8.42 (全12H, m)。

【1127】実施例155の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.96-3.94, 4.40-4.62及び5.00-5.20 [全27H, m, 1.12 (t, $J=7.1$ Hz), 2.33 (s), 4.56 (s)], 6.50-7.60及び8.34-8.48 (全12H, m)。

【1128】実施例156の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.96-3.92, 4.31-4.62及び5.0-5.21 [全27H, m, 1.12 (t, $J=7.24$ Hz), 3.77 (s), 4.50 (s)], 6.45-7.65及び8.32-8.52 (全12H, m)。

【1129】実施例157の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.84-4.15, 4.39-4.62及び5.05-5.40 [全24H, m, 1.11 (t, $J=5.7$ Hz), 5.15 (s), 5.29 (s)], 6.54 (1H, d, $J=6.48$ Hz), 6.78 (1H, d, $J=6.66$ Hz), 6.98-7.75及び7.95-8.12 [全11H, m, 7.35 (s), 7.99 (s)]。

【1130】実施例158の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.61 (3H, d, $J=5.16$ Hz), 0.97 (3H, d, $J=5.28$ Hz), 1.12-5.15及び5.76-5.86 [全15H, m, 2.51 (s), 4.63 (s)], 6.38-8.75 [全12H, m, 8.47 (s)]。

【1131】実施例159の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.11-4.20及び4.31-4.62 [全21H, m, 4.53 (s), 4.62 (s)], 2.46 (3H, s), 6.35-7.68及び8.18-8.56 (全12H, m)。

【1132】実施例160の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.81-4.29, 4.31-4.71及び4.95

-5.13 [全28H, m], 1.02 (t, $J=5.66$ Hz), 1.15 ($J=5.78$ Hz), 4.54 (s), 4.63 (s)], 6.35-7.76及び8.23-8.69 [全13H, m, 8.53 (s)]。

【1133】実施例161の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.79-4.72及び4.90-5.08 [全22H, m, 2.45 (s), 4.51 (s), 4.61 (s)], 6.30-7.69及び8.21-8.63 [全12H, m, 6.38 (d, $J=6.80$ Hz), 6.50 (d, $J=6.66$ Hz), 8.53 (s)]。

【1134】実施例162の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.72-4.01, 4.31-4.73及び4.89-5.18 [全14H, m, 2.50 (s), 4.52 (s), 4.64 (s), 5.04 (s)], 5.80-7.70及び8.12-8.58 [全12H, m, 6.54 (d, $J=6.64$ Hz), 8.42 (s)]。

【1135】実施例163の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.81-3.59 [全15H, m, 1.22 (t, $J=5.96$ Hz), 2.39 (s), 2.98 (q, $J=5.94$ Hz)], 4.75-5.05 (1H, m), 6.50-7.62 [全8H, m, 6.60 (d, $J=6.20$ Hz), 6.85 (t, $J=6.10$ Hz), 7.01 (t, $J=5.96$ Hz), 7.56 (s)]。

【1136】実施例165の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
0.36-1.15, 1.35-3.89及び4.98-5.09 [全30H, m, 2.27 (s), 2.29 (s)], 5.65-6.70 (全11H, m)。

【1137】実施例167の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.92 (6H, d, $J=5.36$ Hz), 1.35-3.13, 3.28-3.58, 3.69-4.01及び4.82-5.09 [全14H, m, 2.40 (s), 3.88 (d, $J=5.24$ Hz)], 6.42-7.40 [全8H, m, 7.00 (t, $J=5.84$ Hz)]。

【1138】実施例173の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.01-4.10, 4.41-4.68及び4.92-5.15 [全26H, m, 2.33 (s), 2.52 (s), 3.88 (s)], 6.35-7.60 [全10H, m, 6.59 (d, $J=8.35$ Hz)]。

【1139】実施例174の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.01-4.12, 4.45-4.70及び4.92-5.16 [全26H, m, 2.33 (s), 2.53 (s), 3.88 (s)], 6.41-7.63 (全11H, m)。

【1140】実施例175の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.52 (3H, d, $J=6.52\text{Hz}$), 0.96 (3H, d, $J=6.59\text{Hz}$), 1.05-2.15, 2.21-4.67及び5.60-5.76 [全16H, m, 2.59 (s), 3.88 (s)], 6.29-7.62 (全11H, m)。

【1141】実施例176の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.15-2.20, 2.49-4.61及び5.01-5.28 [全17H, m, 3.74 (s), 3.77 (s), 4.51 (s)], 6.38-7.60及び8.21-8.49 [全12H, m, 6.55 (d, $J=8.32\text{Hz}$)]。

【1142】実施例177の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.18-2.31, 2.51-3.96及び4.26-5.51 [全15H, m, 3.77 (s), 4.53 (s)], 6.40-6.69, 6.81-7.00, 7.08-7.51及び8.25-8.41 (全12H, m)。

【1143】実施例179の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.21-2.30, 2.55-3.96及び4.25-5.80 [全15H, m, 3.76 (s), 4.49 (s)], 6.39-6.65, 6.78-7.51及び8.25-8.45 [全12H, m, 6.55 (s), $J=8.32\text{Hz}$]]。

【1144】実施例180の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.15-4.65及び5.05-5.21 [全18H, m, 2.51 (s), 3.84 (s), 3.88 (s)], 6.40-7.42 [全10H, m], 6.60 (d, $J=7.62\text{Hz}$)]。

【1145】実施例181の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.14-4.36, 4.45-4.83及び5.0-5.25 [全18H, m], 2.56 (s), 3.71 (s), 3.81 (s)], 6.43-7.78 [全11H, m], 6.68 (d, $J=7.67\text{Hz}$)]。

【1146】実施例182の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-2.30, 2.45-3.94及び4.44-4.65 [全12H, m, 2.52 (s), 3.72 (s)], 6.42-6.77 (1H, m), 6.80

-7.55 (6H, m), 8.35-8.75 (2H, m)。

【1147】実施例183の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.19-4.01, 4.42-4.69及び5.0-5.21 [全15H, m, 2.55 (s), 3.81 (s)], 7.49-7.60 (全11H, m)。

【1148】実施例184の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.06-4.05, 4.39-4.65及び4.99-5.20 [全15H, m], 2.50 (s), 3.80 (s)], 6.35-7.52 [全10H, m], 6.72 (d, $J=7.32\text{Hz}$)]。

【1149】実施例185の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.18-3.65, 3.92-4.30及び4.80-5.10 [全13H, m], 2.43 (s), 4.10 (s)], 6.46-7.58及び8.01-8.49 [全7H, m, 6.62 (d, $J=5.48\text{Hz}$), 6.74 (d, $J=6.66\text{Hz}$)]。

【1150】実施例186の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.11-4.78及び5.02-5.20 [全14H, m, 2.44 (s), 4.62 (s)], 6.44-7.15及び8.19-8.51 [全12H, m, 6.55 (d, $J=8.36\text{Hz}$)]。

【1151】実施例187の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.19-2.30, 2.52-3.31, 3.42-4.78及び5.09-5.28 [全17H, m, 3.74 (s), 3.91 (s), 4.61 (s)], 6.42-7.58及び8.85-9.10 [全12H, m, 5.80 (d, $J=8.36\text{Hz}$)]。

【1152】実施例188の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.19-4.80及び5.09-5.18 [全14H, m, 3.88 (s), 4.59 (s)], 5.72-7.60及び8.87-9.12 [全13H, m, 6.56 (d, $J=8.4\text{Hz}$)]。

【1153】実施例189の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.08-4.23, 4.38-4.68及び5.03-5.19 [全17H, m, 3.74 (s), 3.79 (s), 4.54 (s)], 6.31-7.80及び8.10-8.71 (全12H, m)。

【1154】実施例190の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.18-3.29, 3.41-4.69及び5.07-5.27 [全17H, m, 2.34 (s), 3.74 (s), 4.57 (s)], 6.43-7.71及び

8. 21-8. 50 [全12H, m, 6. 58 (d, J=6. 36Hz), 6. 85 (d, J=8. 21Hz)]。

【1155】実施例192の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 09-3. 85, 4. 01-4. 71及び5. 01-5. 20 [全17H, m, 2. 46 (s), 3. 74 (s), 4. 64 (s)], 6. 31-7. 65及び8. 05-8. 41 [全13H, m, 6. 55 (d, J=8. 34Hz)]。

【1156】実施例193の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 18-4. 73及び5. 03-5. 26 [全11H, m, 4. 57 (s)], 6. 49-7. 52及び8. 20-8. 41 [全13H, m, 6. 55 (d, J=8. 39Hz)]。

【1157】実施例194の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 19-3. 90, 4. 28-4. 72及び5. 09-5. 26 [全14H, m, 2. 28 (s), 4. 51 (s)], 5. 60-7. 50及び8. 20-8. 45 [全13H, m, 6. 55 (d, J=8. 58Hz)]。

【1158】実施例195の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 12-4. 65及び5. 03-5. 26 [全14H, m, 2. 33 (s), 4. 54 (s)], 6. 40-7. 51及び8. 21-8. 43 [全12H, m, 6. 55 (d, J=8. 06Hz)]。

【1159】実施例196の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 19-2. 31, 2. 49-4. 65及び5. 08-5. 26 [全14H, m, 3. 74 (s), 4. 57 (s)], 6. 45-6. 67, 6. 80-7. 68及び7. 92-8. 43 [全13H, m, 6. 57 (d, J=8. 22Hz)]。

【1160】実施例197の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 11-2. 22及び2. 41-5. 95 (全9H, m), 5. 14 (2H, s), 6. 62-6. 48及び6. 75-7. 59 [全13H, m, 6. 52 (d, J=8. 24Hz), 7. 34 (s)]。

【1161】実施例198の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 13-4. 70及び5. 03-5. 25 [全17H, m, 2. 30 (s), 3. 74 (s), 4. 53 (s)], 6. 41-7. 65及び7. 91-8. 43 [全13H, m, 6. 56 (d, J=8. 41Hz)]。

【1162】実施例199の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 22, 2. 48-3. 29及び3. 41-4. 80 [全14H, m, 3. 67 (s), 3. 72 (s)], 5. 16 (2H, s), 6. 15-6. 20, 6. 40-6. 68, 6. 75-8. 40及び9. 31-9. 48 [全13H, m, 6. 55 (d, J=8. 24Hz), 7. 36 (s)]。

【1163】実施例201の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 35-2. 25及び2. 70-3. 25 (全7. 2H, m), 3. 45 (2. 5H, s), 3. 52 (0. 5H, s), 3. 94 (1. 7H, s), 4. 03 (0. 3H, s), 4. 75-5. 10 (0. 8H, m), 6. 75-7. 95 (7. 2H, m), 8. 18 (0. 7H, s), 8. 40 (0. 1H, s)。

【1164】実施例202の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 10-5. 0 (28H, m), 6. 60-7. 80 (11H, m), 10. 0-10. 5 (1H, m), 11. 0-11. 8 (1H, m)。

【1165】実施例203の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 35-2. 25, 2. 60-3. 15及び4. 85-5. 05 (全8H, m), 2. 45及び2. 49 (全3H, 各s), 2. 95及び2. 97 (全6H, 各s), 4. 53及び4. 65 (全2H, 各s), 6. 26-7. 55 (11. 3H, m), 8. 17 (0. 7H, s)。

【1166】実施例205の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 20-3. 80及び4. 30-4. 60 [全23H, m, 2. 34 (s), 2. 37 (s)], 4. 63及び4. 73 (全2H, 各s), 6. 40-7. 80 (12H, m), 10. 1及び10. 35 (全1H, 各s), 10. 7-11. 4 (1H, m)。

【1167】実施例206の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 10-4. 90 [全28H, m, 4. 64 (s), 4. 66 (s), 4. 77 (s), 4. 86 (s)], 6. 65-8. 05 (12H, m), 10. 4-11. 5 (2H, m)。

【1168】実施例207の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 20-2. 10及び2. 70-4. 90 [全25H, m, 3. 70 (s)], 1. 87 (3H, s), 6. 50-7. 70 (11H, m), 10. 1-11. 4 (2H, m)。

【1169】実施例208の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 20-2. 20, 2. 20-3. 20, 3. 20-

4. 0及び4. 30-4. 50 [全25H, m, 2. 29 (s)], 5. 70-6. 10, 6. 51-7. 40及び7. 40-8. 00 (全13H, m)。

【1170】実施例209の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 35-2. 15, 2. 70-3. 10及び4. 80-5. 00 (全10H, m), 3. 66及び3. 76 [全2H, 各t, $J=5. 8\text{Hz}$], 4. 60及び4. 71 [全2H, 各s], 6. 70-7. 50 (12H, m)。

【1171】実施例210の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 20-2. 30, 2. 70-3. 20及び4. 40-5. 20 (全10H, m), 6. 25-8. 10 (13H, m)。

【1172】実施例211の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 35-2. 20, 2. 70-3. 15, 3. 20-3. 60, 3. 90-4. 25及び4. 85-5. 05 (全13H, m), 6. 21 (0. 6H, dd, $J=8. 4\text{Hz}$, $J=2. 2\text{Hz}$), 6. 50 (0. 7H, d, $J=1. 8\text{Hz}$), 6. 70 (0. 9H, d, $J=8. 4\text{Hz}$), 6. 80-7. 40 (9. 8H, m)。

【1173】実施例214の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 20-4. 60 [全20H, m, 2. 33 (s)], 5. 15及び5. 21 (全2H, 各s), 6. 70-8. 10 (12H, m)。

【1174】実施例220の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 35-1. 75 (1H, m), 1. 85-2. 25 (3H, m), 2. 75-3. 25 (3H, m), 4. 58 (2H, d, $J=5. 6\text{Hz}$), 4. 9-5. 1 (1H, m), 6. 3-6. 5 (1H, m), 6. 58 (1H, d, $J=7. 4\text{Hz}$), 6. 87 (1H, t, $J=7. 6\text{Hz}$), 7. 06 (1H, t, $J=7. 3\text{Hz}$), 7. 19-7. 32 (8H, m), 7. 55 (2H, d, $J=8. 3\text{Hz}$)。

【1175】実施例228の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 20-2. 20, 2. 30-3. 35, 3. 60-3. 90及び4. 40-4. 70 [全14H, m, 2. 45 (s), 4. 48 (s)], 6. 45-7. 60 (12H, m), 8. 28及び8. 49 (全1H, 各s)。

【1176】実施例229の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 30-2. 30, 2. 70-3. 90及び4. 40-4. 60 (全9H, m), 4. 62及び4. 64 (全2H, 各s), 6. 80-7. 65 (12. 5H,

m), 8. 48及び8. 75 (全0. 5H, 各s)。

【1177】実施例230の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 30-2. 20, 2. 70-3. 10, 3. 20-4. 00及び4. 90-5. 10 (全10H, m), 2. 44及び2. 48 (全3H, 各s), 4. 48及び4. 57 (全2H, 各s), 6. 20-7. 35 (11H, m), 8. 12及び8. 30 (全1H, 各s)。

【1178】実施例231の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 20-2. 20, 2. 65-3. 85及び4. 40-4. 65 (全9H, m), 2. 42 (3H, s), 3. 72及び3. 77 (全3H, 各s), 4. 43及び4. 57 (全2H, 各s), 6. 40-8. 10 (12. 2H, m), 8. 36及び8. 64 (全0. 8H, 各s)。

【1179】実施例232の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 2-2. 2, 2. 2-3. 35, 3. 65-3. 75及び4. 40-4. 65 (全9H, m), 2. 29及び2. 33 (全3H, 各s), 2. 42 (3H, s), 4. 44及び4. 57 (全2H, 各s), 6. 60-7. 60 (13. 5H, m), 8. 36及び8. 62 (全0. 5H, 各s)。

【1180】実施例233の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 20-2. 20, 2. 60-3. 65及び4. 20-4. 40 (全9H, m), 2. 31 (3H, s), 5. 10-5. 16 (全2H, 各s), 6. 46 (0. 1H, d, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 65 (0. 9H, d, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 82 (0. 9H, d, $J=8. 4\text{Hz}$), 6. 98-7. 50 (9. 4H, m), 9. 72, 9. 76及び9. 90 (全0. 7H, 各s)。

【1181】実施例234の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 20-1. 65, 1. 80-2. 10, 2. 65-3. 80及び4. 20-4. 40 (全9H, m), 5. 11及び5. 18 (全2H, 各s), 6. 70-7. 80 (11. 3H, m), 10. 0及び10. 2 (全0. 7H, 各s)。

【1182】実施例235の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 20-3. 85及び4. 05-4. 50 [全14H, m, 2. 18 (s)], 5. 50-7. 60 (13. 2H, m), 7. 97及び8. 32 (全0. 8H, 各s)。

【1183】実施例237の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 82-4. 26, 4. 29-4. 62及び4. 97

−5. 22 (全31H, m), 6. 42−8. 18 (7H, m)。

【1184】実施例238の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 08−5. 25 (31H, m), 6. 16−7. 80 (9H, m), 12. 08−13. 75 (1H, m)。

【1185】実施例239の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 91−4. 02, 4. 43−4. 68及び5. 04−5. 23 (全22H, m), 2. 31 (3H, s), 6. 50−7. 74 (11H, m)。

【1186】実施例240の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 51−4. 75 [全28H, m, 2. 31 (s), 3. 90 (s)], 6. 46−7. 63 (10H, m), 12. 01−12. 51 (1H, m)。

【1187】実施例241の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 90−5. 24 (22H, m), 6. 51−7. 72 (12H, m)。

【1188】実施例242の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 17−2. 55 (10H, m), 2. 64−4. 91 [全18H, m, 3. 86 (s), 3. 90 (s)], 6. 79−7. 63 (10H, m), 12. 42−12. 83 (1H, m)。

【1189】実施例243の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 49−2. 68 (4H, m), 2. 15 (3H, s), 2. 69−3. 04及び4. 44−5. 21 (全2H, m), 3. 66, 3. 76, 3. 80及び3. 90 (全6H, 各s), 4. 04−4. 43 (2H, m), 6. 54−7. 62 (10H, m)。

【1190】実施例244の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 45−2. 62 [全7H, m, 2. 13 (s)], 2. 71−3. 06及び3. 07−5. 19 [全8H, m, 3. 65 (s)], 6. 00−7. 65 (11H, m)。

【1191】実施例245の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 00−5. 22 (25H, m), 6. 45−7. 82 (11H, m), 12. 52−13. 54 (1H, m)。

【1192】実施例246の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 14−2. 55, 2. 56−4. 42及び4. 51−4. 95 [全25H, m, 3. 95 (s)], 6. 76−7. 80 (11H, m), 12. 40−12. 98

(1H, m)。

【1193】実施例247の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 21−5. 12 [全28H, m, 2. 15 (s), 2. 30 (s)], 6. 52−7. 72 (10H, m), 12. 08−13. 78 (1H, m)。

【1194】実施例248の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 10−5. 28 (22H, m), 2. 36, 3. 45及び3. 52 (各3H, s), 6. 37−7. 82 (9H, m), 12. 34−13. 35 (1H, m)。

【1195】実施例250の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 14−4. 29及び4. 42−4. 68 [全29H, m, 2. 14 (s), 2. 30 (s)], 6. 47−7. 62 (10H, m), 8. 49−8. 74 (1H, m), 11. 17−12. 00 (1H, m)。

【1196】実施例251の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 10−4. 22, 4. 48−4. 73及び4. 92−5. 19 [全32H, m, 3. 74 (s), 3. 85 (s), 3. 93 (s)], 6. 70−7. 50 (10H, m), 11. 62−12. 22 (1H, m)。

【1197】実施例252の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 09−2. 51, 2. 62−4. 29及び4. 47−4. 88 [全28H, m, 2. 43 (s), 3. 94 (s)], 6. 69−7. 60 (10H, m), 12. 06−13. 01 (1H, m)。

【1198】実施例253の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 08−4. 22, 4. 50−4. 75及び4. 91−5. 10 [全32H, m, 2. 37 (s), 2. 42 (s), 3. 77 (s)], 6. 70−7. 60 (10H, m), 11. 60−12. 50 (1H, m)。

【1199】実施例254の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 05−2. 62及び2. 63−5. 19 [32H, m, 2. 15 (s), 3. 91 (s)], 6. 51−7. 68 (10H, m), 12. 00−12. 39 (1H, m)。

【1200】実施例255の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 64−4. 16及び4. 44−4. 68 [全20H, m, 0. 73 (t, $J=7. 26\text{Hz}$), 2. 29 (s), 2. 55 (s)], 5. 60−5. 85及び6. 48−7. 50 (全11H, m)。

【1201】実施例260の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 62−1. 40, 1. 41−2. 19, 2. 20−

4. 13及び4. 39-4. 69 [全17H, m, 0. 73 (t, J=7. 25Hz), 2. 57 (s)], 5. 60-5. 89及び6. 31-7. 73 (全12 H, m)。

【1202】実施例262の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 38-1. 82, 1. 83-2. 35, 2. 40-2. 58, 2. 65-3. 78及び4. 82-5. 15 [全14H, m, 2. 12 (s), 2. 45 (s)], 6. 60 (1H, d, J=8. 36Hz), 6. 68-6. 90及び6. 97-7. 48 (全9H, m)。

【1203】実施例263の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 19-2. 24, 2. 37-2. 60, 2. 64-3. 92及び4. 81-5. 15 [全11H, m, 2. 48 (s)], 6. 61 (1H, d, J=8. 38Hz), 6. 71-6. 92及び7. 02-7. 68 (全10H, m)。

【1204】実施例264の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 16-4. 38, 4. 45-4. 68及び4. 95-5. 18 [全32H, m, 1. 32 (t), 2. 12 (s), 2. 29 (s), 2. 50 (s), 3. 30 (s)], 6. 40-7. 68 (10H, m), 11. 48-12. 38 (1H, m)。

【1205】実施例265の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 74-4. 08及び4. 42-4. 69 [全18 H, m, 2. 29 (s), 2. 54 (s)], 5. 59-5. 80及び6. 29-7. 51 (全11H, m)。

【1206】実施例266の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 75-4. 05, 4. 40-4. 66, 4. 76-5. 09, 5. 36-5. 81及び6. 30-7. 68 [全25H, m, 2. 57 (s), 4. 96 (br s), 6. 45 (br s)]。

【1207】実施例267の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 76-2. 60及び2. 61-4. 92 [全31 H, m, 2. 08 (s), 3. 85 (s)], 6. 30-7. 50 (9H, m), 12. 22-12. 86 (1 H, m)。

【1208】実施例268の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 73-2. 56及び2. 57-4. 94 [全31 H, m, 2. 28 (s), 2. 39 (s), 3. 87 (s)], 6. 52-7. 52 (9H, m), 12. 17-13. 00 (1H, m)。

【1209】実施例269の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:

1. 14-4. 08, 4. 41-4. 68, 4. 82-5. 09, 5. 37-5. 96及び6. 30-7. 58 [全27H, m, 2. 29 (s), 2. 54 (s), 5. 00 (br s), 6. 45 (br s)]。

【1210】実施例270の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 10-4. 29, 4. 41-4. 68及び4. 96-5. 15 [全29H, m, 2. 53 (s), 3. 31 (s)], 6. 38-7. 72 (11H, m), 11. 64-12. 47 (1H, m)。

【1211】実施例271の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 80-4. 98 [23H, m, 2. 52 (s), 2. 58 (d, J=4. 4Hz)], 6. 47-7. 72 (11H, m), 12. 56-13. 30 (1H, m)。

【1212】実施例272の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 58-4. 00, 4. 12-4. 68及び5. 06-5. 24 [全14H, m, 1. 63 (s)], 5. 45-5. 82及び6. 49-8. 09 (全17H, m)。

【1213】実施例273の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 08-5. 20 [全20H, m, 2. 85 (s)], 6. 48-6. 72, 6. 81-7. 08及び7. 09-7. 79 [全16H, m, 6. 74 (d, J=8. 2Hz)], 12. 62-13. 78 (1H, m)。

【1214】実施例274の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 04-5. 24 (22H, m), 6. 38-6. 71及び6. 72-7. 60 (全16H, m), 12. 49-13. 31 (1H, m)。

【1215】実施例275の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 10-5. 19 [20H, m, 1. 74 (s)], 6. 41-6. 68及び6. 79-7. 60 (全16 H, m)。

【1216】実施例276の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 78-2. 34, 2. 35-4. 48, 4. 49-4. 74及び4. 92-5. 12 [全35H, m, 1. 39 (t, d, J=7. 0Hz), 1. 83 (s), 3. 90 (s), 3. 93 (s), 3. 95 (s), 3. 98 (s)], 6. 70-7. 60 (9H, m), 11. 61-12. 24 (1H, m)。

【1217】実施例277の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 75-2. 28, 2. 29-4. 33, 4. 50-

4. 76及び4. 91-5. 13 [全32H, m, 1. 85 (s), 2. 39 (s), 2. 45 (s), 3. 30 (s), 3. 77 (s), 3. 99 (s)], 6. 70-7. 58 (10H, m), 11. 58-12. 27 (1H, m)。

【1218】実施例278の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 12-4. 29及び4. 42-4. 93 [全26H, m, 1. 41 (t, $J=7. 3\text{Hz}$), 2. 53 (s), 3. 87 (s)], 6. 58-7. 68 (11H, m), 12. 52-13. 50 (1H, m)。

【1219】実施例279の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 48-1. 41, 1. 49-2. 88, 2. 94-3. 28, 3. 32-4. 80及び5. 31-5. 62 [全22H, m, 0. 52 (d, $J=6. 5\text{Hz}$), 0. 96 (d, $J=6. 5\text{Hz}$), 2. 58 (s), 3. 87 (s)], 6. 37-6. 79及び6. 80-7. 75 (全12H, m)。

【1220】実施例283の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 10-2. 96, 2. 97-3. 91, 4. 05-4. 61及び5. 05-5. 19 [全20H, m, 1. 63 (s), 2. 87 (d, $J=4. 5\text{Hz}$)], 5. 49-5. 78, 6. 07-6. 32, 6. 46-6. 69及び6. 81-7. 62 (全9H, m)。

【1221】実施例284の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 79-4. 32, 4. 33-4. 66及び4. 99-5. 26 [全34H, m, 1. 41 (t, $J=5. 8\text{Hz}$), 3. 31 (s)], 6. 02-6. 37, 6. 45-6. 68及び6. 78-7. 81 (全8H, m), 11. 83-12. 39 (1H, m)。

【1222】実施例285の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 17-3. 40, 3. 52-4. 10, 4. 11-4. 62及び5. 04-5. 23 [全36H, m, 1. 41 (t, $J=7. 18\text{Hz}$), 3. 31 (s)], 6. 05 (1H, t, $J=6. 68\text{Hz}$), 6. 51-6. 69及び6. 82-7. 68 (7H, m), 11. 99-12. 39 (1H, m)。

【1223】実施例286の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 35-0. 65, 0. 80-2. 12, 2. 13-2. 88, 2. 89-3. 23, 3. 32-4. 24, 4. 34-4. 65, 5. 26-5. 47及び6. 31-7. 44 [全38H, m, 0. 50 (d, $J=6. 5\text{Hz}$), 0. 94 (d, $J=6. 5\text{Hz}$), 2. 49 (s)]。

【1224】実施例287の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 50-0. 81, 1. 00-2. 13, 2. 14-3. 17, 3. 21-4. 00, 4. 36-4. 62, 5. 48-5. 71及び6. 39-7. 43 [全38H, m, 0. 65 (t, $J=7. 3\text{Hz}$), 2. 49 (s)]。

【1225】実施例288の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 81-2. 55 (5H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 56-3. 97, 4. 31-4. 70及び5. 08-5. 50 (全4H, m), 6. 50-7. 83 (12H, m)。

【1226】実施例289の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 49 [全8H, m, 1. 95 (s)], 2. 59-3. 94, 4. 00-4. 25, 4. 40-4. 67及び5. 09-5. 29 [全13H, m, 3. 47 (s), 3. 55 (s), 3. 68 (s)], 6. 30-7. 48 (9H, m)。

【1227】実施例291の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 27 (5H, m), 2. 52-4. 33, 4. 51-4. 73及び5. 00-5. 19 [全13H, m, 3. 70 (s), 3. 74 (s), 3. 75 (s)], 6. 71-7. 54 (10H, m)。

【1228】実施例292の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 27-2. 42 (5H, m), 2. 36 (3H, s), 2. 58-3. 07 (2H, m), 3. 10-4. 31, 4. 38-4. 67及び5. 19-5. 29 [全11H, m, 3. 53 (s), 3. 68 (s)], 6. 41-7. 48 (9H, m)。

【1229】実施例293の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 09-2. 42 (5H, m), 2. 58-4. 24, 4. 49-4. 74及び5. 01-5. 22 (全10H, m), 5. 24-7. 56 (11H, m)。

【1230】実施例294の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 18-2. 58 (4H, m), 2. 35 (3H, s), 2. 60-4. 09, 4. 36-4. 68及び5. 02-5. 30 (全5H, m), 3. 49 (6H, s), 6. 31-7. 49 (10H, m)。

【1231】実施例295の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 16-2. 47 (4H, m), 2. 58-3. 40, 3. 41-4. 38, 4. 39-4. 68及び5. 09-5. 30 (全11H, m), 3. 67及び3. 71 (各3H, 各s), 6. 55-7. 83 (11H, m)。

【1232】実施例296の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 19-2. 39 (4H, m), 2. 51-3. 9
5, 4. 36-4. 64及び5. 05-5. 31 [全8
H, m, 3. 65 (s)], 6. 50-7. 80 (11
H, m), 8. 99-10. 36 (1H, m)。

【1233】実施例297の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 18-2. 34, 2. 58-3. 30, 3. 31-
4. 37, 4. 51-4. 72及び5. 01-5. 19
[全15H, m, 3. 76 (s)], 6. 71-7. 6
9 (11H, m)。

【1234】実施例298の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 29 (4H, m), 2. 57-3. 2
1, 3. 30-4. 13, 4. 49-4. 72及び4.
99-5. 21 [全8H, m, 3. 73 (s)], 5.
41-7. 69 (12H, m)。

【1235】実施例299の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 12-2. 22, 2. 24-2. 52, 2. 57-
3. 19, 3. 28-4. 41, 4. 51-4. 73及
び4. 99-5. 20 [全18H, m, 2. 37
(s), 3. 76 (s)], 6. 71-7. 58 (10
H, m)。

【1236】実施例300の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 07-4. 14及び4. 15-5. 58 [全16
H, m, 2. 35 (s), 3. 73 (s)], 6. 62
-7. 64 (10H, m)。

【1237】実施例301の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 13-2. 31 [全10H, m, 1. 90
(s)], 2. 54-3. 23, 3. 33-3. 97,
4. 05-4. 31, 4. 51-4. 71及び5. 01
-5. 18 [全11H, m, 3. 74 (s)], 6. 3
1-7. 50 (9H, m)。

【1238】実施例302の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 14-2. 22 (4H, m), 2. 57-3. 2
0, 3. 36-4. 35, 4. 50-4. 71及び5.
02-5. 20 [全17H, m, 3. 76 (s), 3.
91 (s), 3. 93 (s)], 6. 71-7. 55
(9H, m)。

【1239】実施例303の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 11-2. 51 [全7H, m, 2. 39 (s)],
2. 57-3. 21, 3. 22-4. 35, 4. 51-
4. 73及び5. 01-5. 19 [全11H, m, 3.
76 (s)], 6. 70-7. 55 (10H, m)。

【1240】実施例304の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 49 [全10H, m, 2. 11 (s),
2. 34 (s)], 2. 56-3. 22, 3. 30-
4. 32, 4. 49-4. 73及び5. 02-5. 19
[全11H, m, 3. 67 (s), 3. 74 (s)],
6. 48-7. 52 (9H, m)。

【1241】実施例307の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 09-2. 25 (4H, m), 2. 37及び2. 4
4 (全3H, 各s), 2. 55-3. 30, 3. 31-
4. 22及び4. 49-6. 21 [全9H, m, 3. 7
3 (s)], 6. 70-7. 58 (10H, m)。

【1242】実施例309の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 14-4. 23, 4. 42-4. 69及び5. 03
-5. 25 [全18H, m, 2. 13 (s), 2. 48
(s), 3. 71 (s)], 6. 30-7. 54 (10
H, m)。

【1243】実施例310の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 17-2. 29 (4H, m), 2. 39-4. 3
2, 4. 43-4. 65及び5. 02-5. 22 [全1
1H, m, 2. 51 (s), 3. 74 (s)], 6. 4
1-7. 69 (11H, m)。

【1244】実施例311の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 05-3. 99, 4. 38-4. 65及び5. 01
-5. 22 [全15H, m, 2. 12 (s), 2. 47
(s)], 6. 40-7. 48 (10H, m)。

【1245】実施例312の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 12-2. 34 (4H, m), 2. 35-4. 0
9, 4. 40-4. 68及び5. 03-5. 25 [全8
H, m, 2. 50 (s)], 6. 40-7. 70 (11
H, m)。

【1246】実施例313の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 19-2. 52, 2. 53-3. 94, 3. 97-
4. 32, 4. 37-4. 62及び5. 07-5. 28
[全20H, m, 3. 74 (s)], 6. 00-6. 3
2, 6. 40-6. 68, 6. 70-7. 01及び7.
02-7. 40 (全8H, m)。

【1247】実施例314の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 08-2. 37, 2. 38-3. 92, 4. 01-
4. 64及び5. 08-5. 28 [全22H, m, 3.
74 (s)], 6. 07 (1H, t, $J=6.7\text{H}$
z), 6. 41-6. 71及び6. 72-7. 41 (全
7H, m)。

【1248】実施例315の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 12-2. 31, 2. 48-3. 32, 3. 37-3. 82, 3. 83-4. 36, 4. 37-4. 58及び5. 10-5. 25 [全12H, m, 1. 58 (s), 3. 59 (s)], 6. 43-6. 66及び6. 79-7. 52 (全16H, m)。

【1249】実施例316の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 22-3. 06, 3. 07-3. 25, 3. 32-3. 79, 4. 38-4. 60及び5. 08-5. 24 [全9H, m, 3. 48 (s), 3. 58 (s)], 6. 42-6. 63及び6. 78-8. 51 (全17H, m)。

【1250】実施例317の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 12-2. 52, 2. 53-3. 33, 3. 34-3. 88, 3. 89-4. 65, 5. 08-5. 25 (全17H, m), 5. 99-6. 36, 6. 44-6. 70及び6. 78-7. 55 (全9H, m)。

【1251】実施例318の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 16-3. 32, 3. 33-4. 62及び5. 08-5. 26 (全19H, m), 6. 05 (1H, t, $J=6. 7\text{Hz}$), 6. 48-6. 74及び6. 75-7. 81 (全8H, m)。

【1252】実施例319の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 19-2. 30, 2. 57-3. 90, 3. 91-4. 67及び5. 12-5. 31 [全12H, m, 1. 59 (s), 3. 75 (s)], 6. 49-6. 74及び6. 81-7. 87 (全16H, m)。

【1253】実施例320の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 18-2. 26 (4H, m), 2. 55-3. 36, 3. 37-3. 90, 4. 38-4. 62及び5. 10-5. 30 (全5H, m), 6. 50-6. 71及び6. 82-7. 81 (全17H, m)。

【1254】実施例321の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 18-2. 39, 2. 40-4. 27, 4. 46-4. 68及び5. 06-5. 22 [全18H, m, 2. 52 (s), 3. 72 (s), 3. 82 (s) 及び3. 87 (s)], 6. 48-7. 68 (11H, m)。

【1255】実施例322の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 86-4. 31, 4. 43-4. 67及び5. 03-5. 20 [全26H, m, 2. 43 (s), 2. 47 (s), 3. 72 (s)], 6. 41-7. 46 (7H, m)。

【1256】実施例323の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 07-4. 31, 4. 40-4. 67及び5. 02-5. 20 [全28H, m, 2. 43 (s), 2. 47 (s), 3. 72 (s)], 6. 40-7. 46 (7H, m)。

【1257】実施例324の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-4. 31, 4. 43-4. 65及び5. 02-5. 20 [全24H, m, 2. 43 (s), 2. 48 (s), 3. 71 (s)], 6. 44-7. 48 (7H, m)。

【1258】実施例325の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 98-5. 26 [24H, m, 2. 43 (s), 2. 48 (s)], 6. 42-7. 53 [7H, m, 6. 64 (d, $J=7. 3\text{Hz}$)]。

【1259】実施例326の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 03-4. 04, 4. 42-4. 64及び5. 01-5. 21 [全25H, m, 2. 43 (s), 2. 48 (s)], 6. 41-7. 45 (7H, m)。

【1260】実施例327の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 04-4. 01, 4. 40-4. 66及び5. 02-5. 22 [全21H, m, 2. 43 (s), 2. 48 (s)], 6. 43-7. 48 (7H, m)。

【1261】実施例328の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 14-2. 28, 2. 38-4. 02, 4. 41-4. 68及び5. 02-5. 22 [全15H, m, 2. 51 (s), 2. 56 (s), 3. 78 (s)], 6. 48-7. 62 (11H, m)。

【1262】実施例329の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 32 (4H, m), 2. 43-4. 32, 4. 45-4. 68及び5. 03-5. 22 [全11H, m, 2. 55 (s), 2. 58 (s), 3. 73 (s)], 6. 43-7. 80 (16H, m)。

【1263】実施例332の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 54-1. 04, 1. 05-2. 25, 2. 26-4. 18, 4. 36-4. 74及び5. 52-5. 84 [全17H, m, 0. 67 (t, $J=7. 3\text{Hz}$), 2. 60 (s)], 6. 38-7. 82 (17H, m)。

【1264】実施例333の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 9-4. 2, 4. 4-4. 65及び5. 0-5. 25 (全22H, m), 6. 45-6. 67及び6. 78

−7. 88 [全13H, m, 6. 58 (d, J=8. 3 Hz)]。

【1265】実施例334の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 9−4. 1, 4. 45−4. 65及び5. 0−5. 2 [全22H, m, 1. 23 (t, J=7. 1 Hz)], 6. 35−7. 55 (13H, m)。

【1266】実施例335の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 06 (3H, t, J=7. 2 Hz), 1. 1−1. 55 (5H, m), 1. 6−2. 0 (5H, m), 2. 2−2. 7 (9H, m), 3. 4−3. 9 (7H, m), 4. 55−4. 85 (1H, m), 6. 19 (1H, t, J=5. 5 Hz), 6. 62 (1H, d, J=8. 2 Hz), 6. 8−7. 1 (1H, m), 6. 99 (2H, d, J=7. 9 Hz), 7. 16 (2H, d, J=7. 9 Hz), 7. 33 (1H, d, J=2. 4 Hz)。

【1267】実施例336の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 05 (3H, t, J=7. 2 Hz), 2. 2−2. 7 (8H, m), 3. 4−3. 9 (7H, m), 4. 6−4. 9 (1H, m), 6. 21 (1H, t, J=5. 8 Hz), 6. 65 (1H, d, J=8. 3 Hz), 6. 8−7. 1 (1H, m), 7. 2−7. 6 (10H, m)。

【1268】実施例337の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 99及び1. 21 (全6H, 各t, J=7 Hz), 2. 0−2. 8 (7H, m), 3. 0−4. 9 (7H, m), 6. 34 (1H, t, J=5. 5 Hz), 6. 65 (1H, d, J=8. 1 Hz), 6. 75−7. 8 (12H, m)。

【1269】実施例339の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 2−4. 2, 4. 4−4. 7及び5. 0−5. 2 (全19H, m), 6. 5−6. 7 [1H, m, 6. 63 (d, J=7. 1 Hz)], 6. 8−7. 8 (12H, m), 8. 2−8. 7 (1H, m)。

【1270】実施例340の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{CDCl}_3+\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 0−4. 8及び5. 0−5. 2 [全24H, m, 1. 47 (t, J=7. 1 Hz)], 6. 5−8. 0 (13H, m), 8. 9−9. 8 (1H, m), 11. 6−12. 5 (1H, m)。

【1271】実施例341の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 1−2. 3, 2. 4−4. 7及び4. 9−5. 15 (全21H, m), 6. 58 (1H, d, J=7. 7 Hz), 6. 7−7. 8 (12H, m), 8. 35−8.

8 (1H, m)。

【1272】実施例342の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 9−4. 0, 4. 4−4. 7及び5. 0−5. 25 (全21H, m), 6. 5−6. 7 (1H, m), 6. 8−7. 7 (12H, m), 8. 2−8. 5 (1H, m)。

【1273】実施例344の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 9−4. 1, 4. 4−4. 7及び4. 9−5. 15 [全27H, m, 1. 12 (t, J=5. 7 Hz), 2. 49 (s), 4. 52 (s)], 6. 4−7. 7 [12H, m, 6. 62 (d, J=6. 1 Hz)], 8. 1−8. 5 [1H, m, 8. 15 (s), 8. 41 (s)]。

【1274】実施例345の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 9−4. 1, 4. 3−4. 8及び4. 9−5. 1 (全24H, m), 6. 7−8. 0 (11H, m), 8. 3−8. 8 [1H, m, 8. 38 (s), 8. 67 (s)]。

【1275】実施例346の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 0−5. 1 [24H, m, 2. 46 (s), 2. 47 (s), 4. 48 (s), 4. 61 (s)], 6. 35−6. 7 [1H, m, 6. 58 (d, J=5. 5 Hz)], 6. 75−8. 0 (12H, m), 8. 3−8. 7 [1H, m, 8. 42 (s), 8. 59 (s)]。

【1276】実施例350の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 2−4. 2, 4. 4−4. 7及び4. 9−5. 2 [全23H, m, 2. 35 (s), 2. 53 (s)], 6. 4−8. 5 [12H, m, 6. 58 (d, J=8. 3 Hz), 6. 87 (dd, J=8. 3, J=2. 3 Hz), 6. 99 (d, J=2. 2 Hz), 7. 10 (d, J=8. 3 Hz)], 10. 0−10. 04 (1H, m)。

【1277】実施例352の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 05−1. 55及び1. 6−2. 0 [全13H, 1. 25 (t, J=7 Hz)], 2. 2−2. 8 (3H, m), 3. 2−3. 55 (2H, m), 3. 6−3. 9 (1H, m), 4. 0−4. 4 (2H, m), 4. 6−4. 9 (1H, m), 6. 29 (1H, t, J=5. 6 Hz), 5. 62 (1H, d, J=8 Hz), 6. 89 (1H, dd, J=8 Hz, J=2 Hz), 6. 99 (2H, d, J=8. 2 Hz), 7. 18 (2H, d, J=8. 2 Hz), 7. 35 (1H, d, J=2 Hz)。

【1278】実施例353の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-2. 0 (10H, m), 2. 2-2. 8 (3H, m), 3. 2-3. 6 (2H, m), 3. 65-3. 9 (1H, m), 4. 6-4. 95 (1H, m), 6. 28 (1H, t, $J=5.4\text{Hz}$), 6. 61 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6. 8-7. 1 (1H, m), 6. 98 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 21 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 35 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 9. 03 (1H, brs)。

【1279】実施例354の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2. 15-2. 8 (2H, m), 3. 25-3. 6 (2H, m), 3. 65-3. 95 (1H, m), 4. 6-4. 9 (1H, m), 6. 25 (1H, t, $J=5.6\text{Hz}$), 6. 63 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6. 8-7. 0 (1H, m), 7. 2-7. 6 (10H, m), 9. 1 (1H, br)。

【1280】実施例355の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-2. 2, 2. 6-3. 35, 3. 4-3. 95, 4. 0-4. 7及び5. 05-5. 25 [全14H, 3. 72 (s)], 6. 45-6. 7 (1H, m, 6. 63 (d, $J=7.6\text{Hz}$)), 6. 8-7. 5 (12H, m), 8. 15-8. 4 (1H, m)。

【1281】実施例356の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 2-4. 9及び5. 0-5. 25 [全17H, m, 2. 46 (s), 3. 70 (s), 4. 51 (s)], 6. 4-7. 6 (12H, m, 6. 62 (d, $J=8.1\text{Hz}$)), 8. 1-8. 6 (1H, m)。

【1282】実施例357の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-2. 2 (4H, m), 2. 6-3. 0 (2H, m), 3. 1-3. 3, 3. 4-3. 9, 4. 4-4. 7及び4. 9-5. 2 [全8H, m, 3. 73 (s), 4. 56 (s)], 6. 8-8. 0, 8. 2-8. 4及び8. 45-8. 6 (全12H, m)。

【1283】実施例358の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-2. 25 (4H, m), 2. 5-5. 2 (7H, m), 6. 2-8. 1 (11H, m), 8. 3-8. 8 (1H, m, 8. 42 (s))。

【1284】実施例359の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 2-4. 7及び5. 0-5. 2 [全15H, m, 2. 48 (s), 3. 74 (s)], 6. 3-6. 7 (1H, m, 6. 57 (d, $J=8.7\text{Hz}$)), 6. 7-7. 8 (10H, m), 8. 3-8. 8 (1H, m, 8. 41 (s), 8. 72 (s))。

【1285】実施例360の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-4. 7及び5. 0-5. 2 [全15H, m, 2. 49 (s), 3. 68 (s)], 6. 1-8. 0 (10H, m, 6. 60 (d, $J=8.4\text{Hz}$)), 9. 4-9. 8 (1H, m, 9. 54 (s), 9. 75 (s)), 12. 1-12. 4 (1H, m, 12. 27 (s))。

【1286】実施例361の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-3. 9及び4. 3-5. 3 [全12H, m, 2. 45 (s)], 6. 3-6. 7 (1H, m, 6. 57 (d, $J=8.4\text{Hz}$)), 6. 7-7. 8 (10H, m), 8. 40及び8. 65 (全1H, 各s)。

【1287】実施例362の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-3. 9, 4. 2-4. 6及び4. 9-5. 2 [全12H, m, 2. 43 (s)], 6. 3-7. 9 (11H, m, 6. 57 (d, $J=8.3\text{Hz}$)), 8. 44及び8. 74 (全1H, 各s)。

【1288】実施例363の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 7-2. 4 (2H, m), 2. 87 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3. 4-5. 2 (4H, m, 4. 55 (s)), 6. 8-8. 1 (12H, m), 8. 2-8. 7 (1H, m, 8. 35 (s))。

【1289】実施例365の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1. 1-5. 1 (12H, m, 2. 42 (s)), 6. 4-8. 8 (13H, m, 6. 72 (d, $J=8.4\text{Hz}$), 8. 60 (d, $J=8.3\text{Hz}$)), 10. 5-10. 9 (1H, m)。

【1290】実施例366の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 95-4. 05, 4. 48-4. 72及び4. 96-5. 14 [全27H, m, 1. 06 (t, $J=7.3\text{Hz}$), 2. 38 (s)], 6. 48-7. 73 (12H, m, 6. 68 (d, $J=7.5\text{Hz}$))。

【1291】実施例367の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 05 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1. 18-4. 18, 4. 42-4. 72及び4. 97-5. 15 [全24H, m, 2. 34 (s)], 6. 40-6. 68及び6. 73-7. 74 [全11H, m, 6. 61 (d, $J=8.3\text{Hz}$))。

【1292】実施例370の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 05 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1. 20-2. 32, 2. 59-4. 00, 4. 43-4. 72及び5. 03-5. 21 (全13H, m), 6. 51-

7. 72 [全12H, m, 6. 69 (d, J=7. 4 Hz)]。

【1293】実施例371の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 05 (3H, t, J=7. 3Hz), 1. 17-
2. 28, 2. 55-3. 90, 4. 34-4. 66及
び5. 01-5. 22 (全13H, m), 6. 43-
7. 69 [全11H, m, 6. 63 (d, J=8. 3 Hz)]。

【1294】実施例375の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 18-2. 25 (4H, m), 2. 60-3. 15
(3H, m), 3. 35-3. 80 (1H, m), 4.
50-5. 20 (1H, m), 6. 60-6. 72 (1
H, m), 6. 90-7. 00 (1H, m), 7. 02
(1H, d, J=8. 2Hz), 7. 16 (1H, d
d, J=2. 3Hz, J=8. 3Hz), 7. 21-
7. 54 (5H, m)。

【1295】実施例377の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 13-2. 28 (4H, m), 2. 50-3. 18
(3H, m), 3. 31-3. 60 (1H, m), 4.
48-5. 19 (1H, m), 7. 02 (1H, dd,
J=1. 7Hz, J=8. 2Hz), 7. 06-7. 5
2 (9H, m)。

【1296】実施例379の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 17-2. 30 (4H, m), 2. 61-3. 20
(2H, m), 3. 20-3. 45 (1H, m), 3.
50-3. 98 (1H, m), 4. 42-5. 33 (1
H, m), 6. 50-6. 65 (1H, m), 6. 72
-7. 56 (6H, m), 7. 62 (1H, dd, J=
2. 0Hz, J=8. 8Hz), 7. 71 (1H, d,
J=8. 6Hz), 7. 78-8. 08 (4H, m),
8. 12 (1H, d, J=8. 6Hz)。

【1297】実施例383の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 17-2. 22 (7H, m), 2. 69-3. 93
(6H, m), 4. 41-5. 23 (1H, m), 6.
45-7. 73 (11H, m)。

【1298】実施例385の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 28 (7H, m), 2. 56-3. 08
(4H, m), 3. 08-3. 96 (2H, m), 4.
40-5. 21 (1H, m), 6. 40-7. 16 (4
H, m), 7. 16-7. 75 (8H, m)。

【1299】実施例386の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 70-1. 16 (6H, m), 1. 20-3. 66
(18H, m), 3. 66-3. 97 (1H, m),

4. 48-5. 19 (1H, m), 6. 51-7. 21
(2H, m), 7. 21-8. 10 (7H, m)。

【1300】実施例387の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 80-1. 18 (3H, m), 1. 19-2. 58
(10H, m), 2. 58-3. 21 (4H, m),
3. 29-3. 80 (4H, m), 4. 52-5. 11
(1H, m), 6. 40-6. 87 (1H, m), 6.
90-7. 11 (2H, m), 7. 11-7. 44 (4
H, m), 7. 44-7. 68 (3H, m)。

【1301】実施例388の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 85 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 02 (3
H, t, J=7. 1Hz), 1. 15-2. 28 (3
H, m), 2. 38 (4H, q, J=7. 1Hz),
2. 56 (4H, q, J=7. 1Hz), 2. 63-
3. 49 (4H, m), 3. 50-3. 79 (1H,
m), 4. 51-5. 14 (1H, m), 5. 65-
6. 79 (2H, m), 6. 90-7. 10 (2H,
m), 7. 10-7. 21 (1H, m), 7. 10-
7. 62 (6H, m)。

【1302】実施例389の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 82-1. 19 (3H, m), 1. 20-2. 55
(10H, m), 2. 55-3. 19 (4H, m),
3. 19-3. 87 (4H, m), 4. 55-5. 13
(1H, m), 6. 81-7. 72 (10H, m)。

【1303】実施例390の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm
0. 84 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 00 (3
H, t, J=7. 2Hz), 1. 21-2. 42 (8
H, m), 2. 42-2. 68 (4H, m), 2. 68
-3. 46 (3H, m), 3. 52-3. 81 (1H,
m), 4. 53-5. 14 (1H, m), 5. 65-
6. 51 (1H, m), 6. 88-7. 11 (2H,
m), 7. 11-7. 22 (1H, m), 7. 11-
7. 65 (8H, m)。

【1304】実施例391の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 88-1. 27 (3H, m), 1. 30-2. 89
(10H, m), 2. 99-3. 20 (1H, m),
3. 20-4. 12 (7H, m), 4. 45-5. 29
(1H, m), 6. 48-6. 67 (1H, m), 6.
75-6. 90 (1H, m), 7. 02 (1H, d, J
=2. 1Hz), 7. 40-8. 09 (7H, m),
8. 09-8. 20 (2H, m), 8. 31 (1H,
d, J=8. 6Hz)。

【1305】実施例392の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 81-1. 19 (6H, m), 1. 25-2. 30

(4H, m), 2.30-2.77 (7H, m), 2.77-5.30 (6H, m), 6.29-6.78 (2H, m), 6.81 (1H, dd, J=2.2Hz, J=8.3Hz), 7.11-7.38 (1H, m), 7.38-7.66 (3H, m), 7.66-7.89 (2H, m), 7.89-8.24 (4H, m), 8.31 (1H, d, J=8.6Hz)。

【1306】実施例393の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.78-2.30 (5H, m), 2.35 (3H, s), 2.41-2.60 (3H, m), 2.60-3.52 (3H, m), 3.52-4.01 (5H, m), 4.46-5.26 (1H, m), 6.50-6.69 (1H, m), 6.89 (1H, dd, J=2.2Hz, J=8.3Hz), 7.02 (1H, d, J=2.2Hz), 7.09-7.20 (1H, m), 7.28-7.55 (1H, m), 7.60-7.90 (6H, m), 8.38 (1H, s)。

【1307】実施例394の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.79-1.20 (6H, m), 1.29-2.82 (10H, m), 2.82-4.02 [9H, m, 3.00 (s), 3.22 (s)], 4.40-5.25 (1H, m), 6.50-6.68 (1H, m), 6.83-7.20 (3H, m), 7.25-7.52 (1H, m), 7.58-7.87 (6H, m), 8.37 (1H, d, J=5.2Hz)。

【1308】実施例397の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.20-4.18, 4.40-4.72及び4.96-5.20 [全25H, m, 2.34 (s), 2.88 (q, J=7.4Hz)], 6.40-7.85 (11H, m)。

【1309】実施例398の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-4.10, 4.49-4.75及び4.98-5.18 [全25H, m, 2.33 (s)], 6.45-7.72 (12H, m)。

【1310】実施例404の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.18-2.28 (10H, m), 2.54-4.08 (15H, m), 4.18-5.22 (1H, m), 6.50-6.70 (2H, m), 6.72-6.90, (1H, m), 7.08-7.78 (9H, m), 12.02 (1H, brs)。

【1311】実施例408の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-5.15 (17H, m), 2.86 (3H, s), 6.49-6.70 (2H, m), 6.72-6.90 (1H, m), 6.93-7.81 (9H,

m), 12.27 (1H, brs)。

【1312】実施例413の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.46-4.00, 4.27-4.80及び5.03-5.17 (全13H, m), 6.68 (1H, d, J=8.3Hz), 6.80-7.69 (12H, m)。

【1313】実施例415の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35-4.15及び4.80-5.10 (全13H, m), 6.45-7.90 (12H, m)。

【1314】実施例417の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.87 (3H, t, J=7.3Hz), 1.35-2.22, 2.66-3.17及び4.88-5.09 (全10H, m), 4.08 (2H, t, J=7.3Hz), 6.57 (1H, d, J=8.3Hz), 6.89 (1H, dd, J=2Hz, J=8.3Hz), 7.15-7.49 (3H, m), 7.53-7.69 (2H, m), 11.39-11.64 (1H, brs)。

【1315】実施例418の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.99-4.17及び4.45-4.65 [全25H, m, 1.84 (s)], 6.56-6.65, 6.82-7.02及び7.11-7.58 (全6H, m), 7.75-7.96 (1H, m), 8.50-8.66 (1H, m), 8.71-8.93 (1H, m)。

【1316】実施例419の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.64-0.85, 1.10-4.00, 4.40-4.70及び5.58-5.72 (全17H, m), 6.36-7.62 (8H, m), 7.75-7.96 (1H, m), 8.49-8.70 (1H, m), 8.70-8.95 (1H, m)。

【1317】実施例420の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.2-4.2, 4.45-4.6 [全20H, m, 2.04 (s), 2.34 (s)], 5.15及び5.22 (全2H, 各s), 6.8-7.8 (全12H, m)。

【1318】実施例421の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.40-1.85, 1.85-2.14, 2.68-3.10及び4.85-5.06 (全8H, m), 2.53及び2.59 (全3H, 各s), 6.60 (1H, d, J=8.3Hz), 6.85 (1H, dd, J=2.9Hz, J=8.3Hz), 6.96 (1H, d, J=7.9Hz), 7.12-7.22 (2H, m), 7.29, 7.40及び7.58 (全2H, 各s), 7.89-8.09 (1H, m), 8.43-8.66

(1H, m), 8.69-8.86 (1H, m), 8.90-9.11 (1H, m)。

【1319】実施例422の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.75-2.10, 2.32-2.90, 3.20-3.45及び4.70-4.90 (全8H, m), 6.42 (1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 6.71 (1H, dd, $J=2.0\text{Hz}$, $J=6.8\text{Hz}$), 6.85 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.00-7.65 (10H, m)。

【1320】実施例423の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.36-1.73, 1.84-2.25, 2.65-3.16及び4.93-5.16 (全8H, m), 6.61 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.90 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, $J=8.3\text{Hz}$), 7.08-7.70 (10H, m)。

【1321】実施例424の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-4.00及び4.45-4.65 [全23H, m, 1.62, 2.34 (s), 2.54 (s)], 6.55-6.65, 6.82-7.01及び7.10-7.56 (全6H, m), 7.74-7.93 (1H, m), 8.50-8.67 (1H, m), 8.74-8.90 (1H, m)。

【1322】実施例425の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.38-2.22, 2.65-3.15及び4.95-5.12 (全8H, m), 6.61 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.80-7.00 (2H, m), 7.20-7.38 (4H, m), 7.62 (1H, d, $J=9.1\text{Hz}$), 7.98 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.09 (1H, d, $J=6.9\text{Hz}$)。

【1323】実施例426の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.90-1.90, 1.90-2.23, 2.46-2.70及び4.67-4.90 (全8H, m), 8.44 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.75 (1H, dd, $J=2.4\text{Hz}$, $J=8.4\text{Hz}$), 6.92 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.05-7.75及び7.96-8.04 (全6H, m), 8.30-8.45, 8.53-8.74及び8.80-8.87 (全2H, m)。

【1324】実施例433の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.22-3.13, 3.44-3.73及び4.71-4.93 (全8H, m), 6.80 (1H, dd, $J=2.5\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$), 6.96-7.85 (9H, m), 8.63-8.76 (1H, m)。

【1325】実施例436の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-4.2, 4.4-4.7及び5.0-5.2 [全16H, m, 2.34 (s)], 6.5-6.75 (1H, m), 6.8-7.8 [全11H, m, 7.50 (d, $J=6.7\text{Hz}$), 7.70 (d, $J=5.7\text{Hz}$)]。

【1326】実施例438の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.22-3.95, 4.43-4.62及び5.03-5.24 [全30H, m, 2.34 (s)], 6.56及び6.63 (全1H, 各d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.89-7.32 (4H, m), 7.37-7.55 (2H, m)。

【1327】実施例440の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.84-4.00及び4.39-4.60 (全22H, m), 6.23-6.39 (2H, m), 6.50-6.66 (1H, m), 6.82-6.99 (1H, m), 6.99-7.15 (3H, m), 7.15-7.36 (2H, m), 7.42-7.62 (2H, m)。

【1328】実施例441の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.80-4.00及び4.38-4.65 [全32H, m, 1.92 (s), 3.23 (s)], 5.85及び5.87 (全2H, 各s), 6.57 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6.80-7.20 (4H, m), 7.45-7.65 (2H, m)。

【1329】実施例444の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.57-2.34 (4H, m), 2.51-2.90 (2H, m), 4.74-5.23 (2H, m), 6.53-6.76 (2H, m), 6.91-7.62 (9H, m)。

【1330】実施例445の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.75-2.0, 2.2-3.10及び3.45-4.10 (全18H, m), 4.65 (2H, s), 6.66-7.70 [全11H, m, 6.67 (d, $J=8.6\text{Hz}$)], 7.59 (d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.80 (1H, s)。

【1331】実施例446の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.8-2.0及び2.25-2.50 (全6H, m), 2.31 (3H, s), 2.60 (1H, dd, $J=15.7\text{Hz}$, $J=8.3\text{Hz}$), 2.80 (1H, dd, $J=15.7\text{Hz}$, $J=5.7\text{Hz}$), 3.45-3.60 (3H, m), 3.60-3.80 (2H, m), 3.89 (2H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 4.60 (2H, s), 6.67 (1H, d, $J=8.$

7 Hz), 6.88 (1H, dd, J=8.7 Hz, J=2.2 Hz), 7.00-7.50 (8H, m), 7.56 (2H, d, J=8.6 Hz), 8.41 (1H, s)。

【1332】実施例447の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.65-2.0及び2.1-2.55 [全12H, m, 2.32 (s), 2.35 (s)], 2.60 (1H, dd, J=15.7 Hz, J=8.2 Hz), 2.80 (1H, dd, J=15.7 Hz, J=5.8 Hz), 3.48-3.52及び3.67-3.72 (全5H, m), 3.89 (2H, t, J=6.6 Hz), 4.59 (2H, s), 6.67 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.78 (2H, d, J=8 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.20 (2H, d, J=8 Hz), 7.37 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.55 (2H, d, J=8.6 Hz), 8.37 (1H, s)。

【1333】実施例448の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.70-2.10, 2.20-2.90及び3.50-4.0 [全21H, m, 2.23 (s), 2.31 (s)], 4.71 (2H, s), 6.68 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.85-7.03, 7.15-7.43及び7.60-7.67 (全11H, m), 9.57 (1H, s)。

【1334】実施例450の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.96-4.70 (29H, m), 1.45 (3H, t, J=7.0 Hz), 4.07 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.58-7.36 (7H, m)。

【1335】実施例455の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.95-4.00, 4.42-4.63及び5.04-5.18 (全22H, m), 6.46-6.67 (1H, m), 6.79-6.95 (1H, m), 6.95-7.25 (4H, m), 7.32-7.51 (2H, m), 7.52-7.75 (2H, m)。

【1336】実施例456の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.95-3.93, 4.41-4.62及び5.01-5.20 [全25H, m, 2.24 (s)], 6.45-6.62 (1H, m), 6.72-6.95 (2H, m), 6.95-7.08 (1H, m), 7.10-7.45 (3H, m), 7.45-7.69 (2H, m)。

【1337】実施例459の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.42 (6H, t, J=7.2 Hz), 1.75-2.05 (1H, m), 2.15-2.40 (1H,

m), 2.40-3.90 (11H, m), 3.94 (2H, t, J=6.5 Hz), 6.73-7.15 (3H, m), 7.25-7.60 (10H, m), 8.35-8.75 (1H, m), 11.3-11.7 (1H, m)。

【1338】実施例460の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.24 (3H, t, J=7 Hz), 1.4-1.5, 1.85-3.30, 3.40-4.20及び4.65-4.85 (全15H, m), 3.72 (2H, q, J=7 Hz), 6.8-7.7 (13H, m), 12.6-12.9 (1H, m)。

【1339】実施例461の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.03 (6H, t, J=7 Hz), 1.75-2.0 (1H, m), 2.10-2.30 (1H, m), 2.35-2.90 (8H, m), 3.35-3.80 (3H, m), 3.90 (2H, t, J=6.6 Hz), 6.72 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.8-7.0 (2H, m), 7.23 (1H, d, J=2.2 Hz), 7.35-7.66 (9H, m)。

【1340】実施例462の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.03 (3H, t, J=7.2 Hz), 1.75-2.0 (1H, m), 2.15-2.40 (1H, m), 2.40-2.90 (8H, m), 3.50-3.60 (3H, m), 3.65-3.85 (2H, m), 3.93 (2H, m), 6.75-7.0及び7.2-7.65 (全12H, m)。

【1341】実施例463の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.20-1.70, 1.70-3.0, 3.0-3.6, 3.6-3.8及び3.8-4.0 (全32H, m), 6.73 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.87 (1H, dd, J=8.6 Hz, J=2.4 Hz), 7.13 (2H, d, J=8 Hz), 7.23 (1H, d, J=2.4 Hz), 7.33 (2H, d, J=8 Hz), 8.4-8.7 (1H, m), 11.2-11.6 (1H, m)。

【1342】実施例464の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.10 (3H, t, J=7.2 Hz), 1.2-1.65, 1.7-2.0, 2.1-2.9, 3.4-3.6, 3.6-3.8及び3.8-4.0 (全28H, m), 6.77 (1H, d, J=8.7 Hz), 6.90 (1H, dd, J=8.7 Hz, J=2.3 Hz), 7.13 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.19 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.31 (2H, d, J=8.2 Hz)。

【1343】実施例467の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.10–2.10, 2.55–4.05, 4.45–4.61及び4.68–4.71 (全41H, m),
6.94–7.38 (3H, m), 12.00–12.27 (1H, brs)。

【1344】実施例469の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20–2.24 (5H, m), 2.63–3.31 (3H, m), 3.70及び3.75 (全3H, s),
4.08–5.20 (1H, m), 6.46–6.62 (1H, m), 6.36–7.00 (1H, m), 7.10–7.48 (3H, m), 8.43–8.56 (2H, m)。

【1345】実施例470の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.05–5.08 (26H, m), 6.15–7.53 (16H, m)。

【1346】実施例471の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.97–2.20, 2.20–4.06及び4.40–4.63 [全36H, m], 1.41 (t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.71 (s), 3.31 (s), 6.59 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6.84–7.60 (6H, m), 12.7–13.4 (1H, brs)。

【1347】実施例472の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20–2.26, 2.50–4.10, 4.40–4.60及び5.00–5.15 (全29H, m),
6.58 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 6.65–7.48 (6H, m), 12.12 (1H, brs)。

【1348】実施例473の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.30–2.20, 2.50–4.10, 4.38–4.60及び4.98–5.16 (全29H, m),
6.50–7.20 (5H, m), 7.36 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 12.15 (1H, brs)。

【1349】実施例476の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.16–4.10及び4.30–4.53 (全35H, m), 6.47–6.80, 6.80–7.65及び7.86–8.10 (全7H, m), 15.51–15.98 (1H, br)。

【1350】実施例477の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.12–2.11 (4H, m), 2.45–3.78 (5H, m), 4.23–5.10 (1H, m), 6.61–7.75 (14H, m)。

【1351】実施例478の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.62 (1.5H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 0.99

(1.5H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.03–5.74 (14H, m), 6.43–7.80 (11H, m)。

【1352】実施例479の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.80–3.90, 4.41–4.64及び5.05–5.70 (全35H, m), 6.49–6.63 (1H, m), 6.71–7.20 (4H, m), 7.20–7.50 (2H, m)。

【1353】実施例480の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.92–2.25, 2.38–3.27, 3.27–4.00, 4.50–4.60及び4.85–5.02 (全29H, m), 6.62–7.45 (6H, m)。

【1354】実施例481の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.82–4.17, 4.36–4.60及び5.07–5.13 [全26H, m, 2.99 (s), 3.23 (s)], 6.40–6.66 (1H, m), 6.75–7.78 (8H, m), 7.84 (1H, d, $J=3.7\text{Hz}$)。

【1355】実施例482の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.77–1.14, 1.14–2.24, 2.24–4.04, 4.33–4.53及び4.97–5.13 [全27H, m, 2.89 (s), 3.14 (s)], 6.42–6.61 (1H, m), 6.77–7.10 (2H, m), 7.28–7.80, 7.80–8.12 [全6H, m, 7.88 (s)]。

【1356】実施例484の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.19–5.33 (22H, m), 6.49–7.32 (12H, m), 11.92–12.70 (1H, m)。

【1357】実施例485の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20–5.28 (20H, m), 1.38 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3.32 (3H, s), 6.61 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.91 (1H, dd, $J=8.3, J=2.2\text{Hz}$), 7.03 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.18–7.76 (9H, m), 11.94 (1H, brs)。

【1358】実施例486の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.19–5.13 (24H, m), 1.35 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.45 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 4.08 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 6.18–7.46 (6H, m), 11.59–12.58 (1H, m)。

【1359】実施例487の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.93-3.98 (26H, m), 4.51-5.15 (1H, m), 4.97及び5.10 (全2H, s), 6.23-7.51 (11H, m)。

【1360】実施例488の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.90-2.12, 2.12-2.40, 2.40-3.63及び4.45-4.84 (全38H, m), 6.98-7.35 (2H, m), 7.38-7.44 (1H, m)。

【1361】実施例489の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.06-5.19 (36H, m), 6.16-7.49 (6H, m), 11.28-11.99 (1H, m)。

【1362】実施例490の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.32-4.57 (22H, m), 1.45 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 2.58及び2.60 (全3H, s), 4.08 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 6.43-6.63 (2H, m), 7.05-7.44 (4H, m), 12.15 (1H, brs)。

【1363】実施例491の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-5.21 (31H, m), 6.11-7.61 (6H, m), 8.54-8.72 (1H, m), 11.27-12.03 (1H, m)。

【1364】実施例492の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.23-5.03 (25H, m), 1.46 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 4.08 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 6.16-7.44 (6H, m), 12.47 (1H, brs)。

【1365】実施例493の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.11-4.67 (29H, m), 4.97-5.10 (全2H, s), 6.22-7.51 (11H, m), 11.43及び12.04 (1H, m)。

【1366】実施例494の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.21-4.62 (26H, m), 4.98及び5.11 (全2H, s), 6.22-7.51 (11H, m), 8.55-8.71 (1H, m), 11.39-11.81 (1H, m)。

【1367】実施例495の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.21-4.90 (22H, m), 1.34 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 4.98及び5.11 (全2H, s), 6.27-7.53 (11H, m), 12.48 (1H, brs)。

【1368】実施例496の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.83-3.98 (24H, m), 2.99及び3.15 (全3H, s), 3.62及び3.86 (全3H, s), 4.49-5.19 (1H, m), 4.97及び5.10 (全2H, s), 6.23-7.53 (11H, m)。

【1369】実施例497の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.18-2.20, 2.60-4.55 (全26H, m), 6.45-6.55 (1H, m), 6.80-6.95 (1H, m), 6.95-7.60 (4H, m), 7.90-8.08 (1H, m), 11.86 (1H, brs)。

【1370】実施例498の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-2.20, 2.55-3.40, 3.40-4.10, 4.35-4.53及び4.96-5.20 (全26H, m), 6.53 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.91 (1H, dd, $J=0.2\text{Hz}$, $J=8\text{Hz}$), 7.04 (1H, d, $J=0.2\text{Hz}$), 7.13 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.40 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 12.15 (1H, s)。

【1371】実施例499の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-2.20, 2.20-3.45, 3.45-4.10及び4.45-4.65 (全29H, m), 6.50-6.62, 6.75-7.55及び7.95-8.07 (全7H, m), 11.8-12.2 (1H, m)。

【1372】実施例500の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.25-3.40, 3.40-4.15及び4.40-4.60 (全29H, m), 6.50-6.62, 6.80-7.45及び7.85-7.95 (全7H, m), 12.06 (1H, brs)。

【1373】実施例501の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-4.10, 4.45-4.60及び5.00-5.20 (全29H, m), 6.56 (1H, d, $J=6.4\text{Hz}$), 6.80-7.50 (5H, m), 7.96 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 12.01 (1H, brs)。

【1374】実施例502の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-4.18及び4.50-4.70 (全29H, m), 6.60-6.90, 6.90-7.51, 7.51-7.66及び8.15-8.22 (全7H, m), 11.8-12.25 (1H, br)。

【1375】実施例503の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.78-3.95, 4.42-4.60及び5.05-5.21 (全26H, m), 6.49-6.62 (1H, m), 6.82-6.98 (1H, m), 6.98-7.52 (6H, m)。

【1376】実施例504の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.16-4.06, 4.43-4.64及び4.92-5.10 (全26H, m), 6.72-7.65 (7H, m), 11.87-12.18 (1H, br)。

【1377】実施例505の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.00-3.95, 4.20-4.44及び4.90-5.05 (全22H, m), 5.10-6.50 (1H, br), 6.65-6.76 (1H, m), 6.90-7.05 (1H, m), 7.20-7.35 (1H, m), 7.35-7.50 (2H, m), 7.70-7.85 (2H, m)。

【1378】実施例508の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.65-0.82, 1.00-2.17, 2.17-2.95, 2.95-3.51, 3.55-3.90, 4.18-4.35, 4.42-4.63, 5.03-5.18及び5.50-5.75 (全25H, m), 6.51-6.68 (1H, m), 6.85-7.45 (5H, m), 7.51-7.65 (1H, m)。

【1379】実施例509の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.49 (3H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 0.95 (3H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 1.1-4.2 [全16H, m, 3.02 (s)], 6.55-6.80 (3H, m), 7.15-7.45 (5H, m)。

【1380】実施例510の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.0-2.2, 2.4-4.0及び4.5-4.6 [全25H, m, 2.87 (s), 3.0 (s)], 6.1-7.5 [全7H, m, 6.26 (dd, $J=8.8\text{Hz}$, $J=2.5\text{Hz}$)]。

【1381】実施例511の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.10-5.35 [24H, m, 2.33 (s)], 6.75-8.26 (7H, m)。

【1382】実施例512の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.1-1.5, 1.5-4.0, 4.4-4.7及び4.9-5.1 (全28H, m, 2.02 (s), 2.18 (s)), 6.13-7.70 (7H, m)。

【1383】実施例516の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.30-1.85, 1.85-2.22, 2.61-

3.16及び4.82-5.06 (8H, m), 2.50及び2.56 (全3H, 各s), 6.55-6.65, 6.78-6.95及び7.10-7.60 (全8H, m), 8.52-8.70 (2H, m)。

【1384】実施例517の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.30-2.30, 2.30-3.15, 3.36-3.60及び4.98-5.08 [全11H, m, 2.49 (s), 2.54 (s)], 6.60 (1H, d, 8.4Hz), 6.75-6.95 (2H, m), 6.95-7.10 (1H, m), 7.10-7.51 (5H, m), 8.38-8.87 (2H, m)。

【1385】実施例520の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
[全6H, m, 0.651 (d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.02 (d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.15 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 1.22 (d, $J=6.5\text{Hz}$)], 1.25-2.22, 2.45-2.90, 3.00-3.21, 3.50-4.00及び4.44-4.67 [全13H, m, 2.57 (s), 2.63 (s)], 6.50-7.96及び8.65-8.95 (11H, m)。

【1386】実施例521の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.1-4.9 [全26H, m, 3.06 (s)], 6.65-7.75 (全7H, m), 12.4-13.2 (1H, m)。

【1387】実施例523の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.18-2.20, 2.29-3.12, 3.29-3.61及び4.81-5.10 [全21H, m, 2.34 (s)], 6.23 (1H, dd, $J=8.72\text{Hz}$, $J=8.73\text{Hz}$), 6.50 (1H, d, $J=2.48\text{Hz}$), 6.56-7.49 (5H, m)。

【1388】実施例524の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.89 (6H, d, $J=6.54\text{Hz}$), 1.32-2.20, 2.30-3.31, 3.42-3.95及び4.82-5.12 (全19H, m), 6.39-7.49 (7H, m)。

【1389】実施例525の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.10-2.20及び2.20-4.90 (全23H, m), 6.35-6.69, 6.69-7.00, 7.00-8.34及び8.65-9.16 (全10H, m), 1.65-12.8 (1H, br)。

【1390】実施例526の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.64, 0.98, 1.16及び1.19 (全6H, 各d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.20-1.49, 1.4

9-2.23, 2.23-4.60及び4.95-5.12 [全13H, m, 2.58 (s), 2.65 (s)], 6.05-6.50, 6.50-6.65, 6.70-6.95, 7.05-7.45, 7.45-7.90, 7.90-8.33及び8.75-9.15 (全12H, m)。

【1391】実施例529の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.13-4.88 (20H, m), 1.19及び1.35 (全9H, s), 2.46, 2.49及び2.51 (全6H, s), 6.58-7.47 (7H, m), 12.76 (1H, brs)。

【1392】実施例530の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35-2.25, 2.36-3.60及び4.47-5.09 [全11H, m, 2.52 (s), 2.58 (s)], 6.60-6.75 (1H, m), 6.75-7.09 (8H, m), 8.52-8.75 (2H, m)。

【1393】実施例531の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.05-2.0, 2.5-4.0及び4.2-4.6 (全24H, m), 6.14-7.5 [全7H, m, 6.16 (d, $J=8.8\text{Hz}$)], 11.1-11.5 (2H, m)。

【1394】実施例532の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.3-2.4, 2.7-4.1, 4.5-4.7及び5.0-5.2 (全9H, m), 6.7-7.8 (12H, m)。

【1395】実施例534の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.30-2.25, 2.40-3.50及び4.86-5.08 [全11H, m, 2.53 (s), 2.58 (s)], 6.00-7.60及び8.55-8.85 (全10H, m)。

【1396】実施例535の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.10-4.90 (23H, m), 6.50-6.66, 6.80-7.68及び8.60-8.91 (全9H, m), 12.77-13.45 (1H, br)。

【1397】実施例541の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 1.00-2.11, 2.12-3.90及び4.18-4.71 [全34H, m, 2.32 (s), 2.36 (s)], 6.40-7.55 (6H, m), 9.82-10.16及び10.80-11.24 (全1H, m)。

【1398】実施例542の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:

1.35-2.15, 2.6-3.15, 3.65-4.0, 4.47, 4.57及び4.85-5.0 [全16H, m, 4.47 (s), 4.57 (s)], 6.48及び6.7-7.45 [全12H, m, 6.48 (s)]。

【1399】実施例544の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.16-4.92 (20H, m), 2.53及び2.59 (全3H, s), 6.54-6.75 (1H, m), 6.91-7.18 (2H, m), 7.23-7.68 (8H, m), 12.83 (1H, brs)。

【1400】実施例545の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.17-5.20 (20H, m), 4.93及び5.11 (全2H, s), 6.53-7.56 (12H, m), 12.34-13.15 (1H, m)。

【1401】実施例547の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.82-5.25 (27H, m), 3.87 (2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 6.53-6.80 (2H, m), 6.83-7.68 (6H, m), 12.32-13.22 (1H, m)。

【1402】実施例553の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.11-4.21, 4.49-4.71及び4.98-5.20 (全25H, m), 6.28-7.61 (1H, m)。

【1403】実施例554の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.19-4.04, 4.48-4.71及び4.97-5.19 [全26H, m, 2.17 (s), 2.21 (s)], 6.42-7.74 (12H, m)。

【1404】実施例555の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.57 (4H, t, $J=5.10\text{Hz}$), 3.32 (4H, t, $J=5.10\text{Hz}$), 3.56 (2H, s), 3.86 (3H, s), 6.74 (1H, dd, $J=8.94\text{Hz}$, $J=8.96\text{Hz}$), 6.85 (1H, d, $J=2.55\text{Hz}$), 7.25-7.45 (5H, m), 7.83 (1H, d, $J=8.91\text{Hz}$)。

【1405】実施例556の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.03-2.22, 2.60-3.15, 3.90-4.28及び4.80-5.00 [全28H, m, 1.45 (s), 3.98 (d, $J=6.31\text{Hz}$)], 6.68-7.42及び7.58-7.71 (全7H, m)。

【1406】実施例558の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 0.9-2.2, 2.6-3.2及び4.5-4.

9 [全15H, m, 4.51 (s), 4.58 (s)], 6.8-7.15, 7.15-7.40及び7.40-7.90 (全12.2H, m), 8.47及び8.7 (全0.8H, 各s)。

【1407】実施例559の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.80-4.08及び4.42-4.69 [全29H, m, 2.40 (s)], 6.58-7.78 [全8H, m, 7.51 (d, $J=2.01\text{Hz}$)]。

【1408】実施例560の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.0-1.25, 1.25-2.25, 2.5-3.7及び4.4-5.0 (全15H, m), 6.73-7.75 (全10H, m), 8.53 (2H, d, $J=5\text{Hz}$)。

【1409】実施例562の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.17-4.86 (26H, m), 6.50-7.65 (10H, m), 12.67 (1H, brs)。

【1410】実施例563の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0.96-2.35及び2.36-4.97 (全20H, m), 6.79-8.06 (12H, m), 10.02-10.46及び11.00-11.60 (全1H, m)。

【1411】実施例564の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.52-2.22, 2.23-4.24, 4.34-4.71及び4.91-5.17 [全14H, m, 0.66 (t, $J=7.3\text{Hz}$)], 5.53-5.74及び6.29-6.58 (全1H, m), 6.89-7.88 (12H, m)。

【1412】実施例565の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1.08-2.21, 2.23-4.08及び4.21-5.11 [全26H, m, 2.31 (s), 2.44 (s)], 6.46-7.78 (11H, m), 10.00-10.28及び10.96-11.45 (全1H, m)。

【1413】実施例566の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.16-2.20, 2.28-4.10, 4.42-4.71及び4.89-5.11 [全25H, m, 2.42 (s), 2.56 (s)], 6.59-7.68 (11H, m)。

【1414】実施例567の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0.79-2.19, 2.29-3.80及び3.96-4.67 (全23H, m), 6.52-7.48及び7.49-8.45 (11H, m), 9.83-1

0.21及び10.86-11.51 (全1H, 各br)。

【1415】実施例572の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.57-0.90, 1.03-2.22, 2.27-4.69及び5.49-5.71 [全20H, m, 0.67 (t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.44 (s), 2.59 (s)], 5.49-5.71及び6.36-7.65 (全12H, m)。

【1416】実施例577の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.3-2.2, 2.65-3.2, 4.0-4.4及び4.8-5.0 (全11H, m), 6.18 (1H, dd, $J=8.4\text{Hz}$, $J=2.4\text{Hz}$), 6.48 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 6.69 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.85-7.45 (9H, m)。

【1417】実施例578の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.2-2.2, 2.5-3.4, 4.15-4.4及び4.7-5.1 (全14H, m), 6.15 (0.8H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.43 (0.94H, s), 6.67 (1.07H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.8-7.5 (9.1H, m)。

【1418】実施例583の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.95-4.9 [全26H, m, 1.10 (t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.47 (d, $J=4\text{Hz}$)], 6.8-7.2, 7.2-7.55, 7.55-8.25及び8.25-8.60 [全14H, m, 8.44 (s)]。

【1419】実施例584の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.666 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.50-4.00 (17H, m), 6.40-7.20 (13H, m)。

【1420】実施例585の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.00-4.20及び4.40-4.35 [全23H, m, 2.50 (s), 2.54 (s)], 6.80-7.65 (12H, m)。

【1421】実施例586の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.45-3.13, 3.20-4.00及び4.20-5.18 (全13H, m), 6.62-7.66 (12H, m)。

【1422】実施例589の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.8-3.7及び4.85-5.15 [全24H, m, 2.37 (s)], 5.9-7.2 [全7H, m, 6.27 (s)]。

【1423】実施例593の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 3-3. 8, 4. 2-4. 8及び4. 9-5. 15
[全12H, m, 3. 36 (s), 3. 48 (s),
4. 55 (s)], 6. 6-7. 95 (12H, m),
8. 15-8. 7 (1H, m)。

【1424】実施例594の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 19-2. 35, 2. 60-3. 15, 3. 75-
4. 20, 4. 30-4. 61及び4. 79-5. 11
(全12H, m), 6. 71-7. 75 (7H, m)。

【1425】実施例595の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 75-3. 30, 3. 30-4. 18及び4. 40
-4. 62 (全20H, m), 6. 55-6. 72 (1
H, m), 6. 72-6. 97 (2H, m), 6. 97
-7. 18 (2H, m), 7. 18-7. 67 (7H,
m)。

【1426】実施例599の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 18-1. 58, 1. 58-4. 29及び4. 50
-4. 85 [全25H, m, 1. 71 (s), 2. 54
(s)], 7. 05-7. 72 (12H, m), 14.
5-17. 8 (1H, brs)。

【1427】実施例601の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 50-2. 20, 2. 20-2. 73及び2. 90
-4. 00 [全16H, m, 1. 62 (s), 2. 59
(s), 3. 24 (s)], 7. 16-7. 69 (12
H, m), 9. 42 (1H, s)。

【1428】実施例606の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 00, 2. 55-2. 90, 3. 35-
3. 70及び4. 40-4. 60 [全27H, m, 1.
57 (s)], 7. 00-7. 34 (3H, m)。

【1429】実施例607の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 15-2. 09, 2. 56-2. 97, 3. 30-
3. 65, 4. 40-4. 60及び4. 71-4. 82
(全24H, m), 6. 95-7. 28 (3H, m)。

【1430】実施例608の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
m: 1. 15-1. 55, 1. 70-2. 35, 2. 5
5-3. 16, 3. 44-3. 65, 4. 20-4. 4
0及び4. 70-5. 07 (全9H, m), 6. 49-
6. 57, 6. 57-6. 85, 6. 9-7. 05及び
7. 05-7. 5 (全8H, m), 7. 62-7. 75
(2H, m)。

【1431】実施例609の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm

m: 1. 15-2. 14, 2. 14-4. 40及び4.
90-5. 54 (全12H, m), 6. 65及び6. 7
2 (全1H, 各d, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 92-7.
46及び7. 60-7. 81 (全8H, m)。

【1432】実施例610の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2. 15-2. 63, 2. 27-3. 18, 3. 55-
4. 06及び5. 82-6. 03 (全8H, m), 7.
46 (1H, d, 8. 3Hz), 7. 78 (1H, d
d, $J=2. 4\text{Hz}$, $J=8. 3\text{Hz}$), 8. 16 (1
H, d, $J=2. 4\text{Hz}$), 8. 21-8. 33 (2
H, m), 8. 54-8. 70 (2H, m), 10. 8
7 (1H, s)。

【1433】実施例611の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 49-1. 76, 1. 86-2. 22, 2. 67-
3. 09及び4. 90-5. 08 (全8H, m), 6.
51 (1H, d, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 89 (1H,
dd, $J=2\text{Hz}$, $J=8. 3\text{Hz}$), 7. 13-7.
35 (3H, m), 7. 42-7. 56 (2H, m)。

【1434】実施例613の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 27-1. 70, 1. 80-2. 30, 2. 68-
3. 37, 3. 40-3. 85, 4. 35-4. 58及
び5. 08-5. 20 (全9H, m), 6. 47及び
6. 54 (全1H, 各d, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 86
-7. 01 (1H, m), 7. 15及び7. 32 (全1
H, 各d, $J=2\text{Hz}$), 7. 35-7. 56 (4H,
m)。

【1435】実施例614の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 75-3. 90, 4. 40-4. 55及び5. 03
-5. 20 (全28H, m), 6. 45-6. 65 (1
H, m), 6. 70-7. 35 (6H, m), 7. 65
-7. 95 (1H, m)。

【1436】実施例615の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 80-3. 90, 4. 35-4. 56, 5. 08-
5. 20及び6. 45-6. 67 (1H, m), 6. 9
0-7. 55 (6H, m), 7. 80-8. 25及び
8. 75-8. 85 (全1H, m)。

【1437】実施例616の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 00-3. 95, 4. 37-4. 57及び5. 00
-5. 17 (全22H, m), 6. 45及び6. 50
(全1H, 各d, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 90 (1H,
dd, $J=2. 3\text{Hz}$, $J=8. 3\text{Hz}$), 6. 96-
7. 06及び7. 29-7. 36 (全2H, m), 7.
44-7. 68 (4H, m)。

【1438】実施例617の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.85-3.92, 4.35-4.52及び4.95-5.15 (全26H, m), 6.40-6.55 (1H, m), 6.85-6.95 (1H, m), 6.95-7.15 (1H, m), 7.30-7.70 (4H, m)。

【1439】実施例618の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.15-2.20, 2.52-3.90, 4.40-4.59及び5.08-5.26 (全22H, m), 6.54-6.68 (1H, m), 6.87-7.44 (6H, m)。

【1440】実施例619の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.15-2.21, 2.47-3.01, 3.07-3.32, 3.41-3.78, 4.35-4.57及び5.08-5.23 (全19H, m), 6.00-6.51 (1H, brs), 6.59 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.89-7.41 (6H, m)。

【1441】実施例622の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.76-2.21, 2.22-4.31, 4.38-4.64及び5.01-5.24 [全23H, m, 2.41 (s), 2.46 (s)], 6.38-7.43 (6H, m)。

【1442】実施例623の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.73-5.18 (24H, m), 6.52-8.03 (8H, m), 12.50-13.30 (1H, m)。

【1443】実施例624の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.93 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.10-2.30 (8H, m), 2.56-4.30 (5H, m), 3.65及び3.70 (全3H, s), 3.88 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 4.38-5.33 (1H, m), 6.51-7.40 (8H, m)。

【1444】実施例626の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.20-2.22 (4H, m), 2.40-5.23 (5H, m), 2.52及び2.56 (全3H, s), 3.72及び3.73 (全3H, s), 6.45-7.70 (10H, m)。

【1445】実施例627の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.17-2.21 (4H, m), 2.61-3.02 (2H, m), 3.09-3.85 (1H, m), 3.69 (3H, s), 4.01-4.27 (1H, m), 4.43-5.18 (1H, m), 4.94及び5.10 (全2H, s), 6.46-6.67 (1H, m),

6.83-7.50 (11H, m)。

【1446】実施例629の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.09-2.32 (4H, m), 2.56-5.33 (5H, m), 3.69及び3.74 (全3H, s), 6.53-7.78 (12H, m)。

【1447】実施例630の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.12-2.18 (4H, m), 1.18及び1.34 (全9H, s), 2.33-5.24 (5H, m), 2.45及び2.49 (全3H, s), 7.32 (3H, s), 6.43-7.51 (7H, m)。

【1448】実施例631の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.08-2.25 (4H, m), 1.18及び1.33 (全9H, s), 2.34-3.96 (5H, m), 2.45及び2.50 (全3H, s), 6.47-7.50 (7H, m), 9.00 (1H, brs)。

【1449】実施例632の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.15-2.35 (7H, m), 2.58-3.28 (3H, m), 3.35-5.20 (10H, m), 6.15-7.56 (6H, m)。

【1450】実施例633の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.16-2.22 (7H, m), 2.58-3.29 (3H, m), 3.35-4.18 (6H, m), 4.45-5.21 (1H, m), 6.12-7.48 (6H, m), 10.82 (1H, brs)。

【1451】実施例634の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1.13-2.21 (4H, m), 2.36-4.31 (4H, m), 2.49 (3H, s), 4.33-5.13 (1H, m), 6.76-7.88 (11H, m), 12.43 (1H, brs)。

【1452】実施例637の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.15-2.33, 2.33-3.99, 3.99-4.31, 4.50-4.65及び5.05-5.18 (全15H, m), 6.50-7.70及び8.10-8.20 (全12H, m)。

【1453】実施例640の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.13-2.26, 2.35-3.90, 4.43-4.66及び5.03-5.22 (全15H, m), 6.40-6.70 (1H, m), 6.73-6.95 (1H, m), 6.95-7.65 (6H, m), 8.50-8.75 (2H, m)。

【1454】実施例641の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:

1. 22-2. 35, 2. 5-3. 3, 3. 4-3. 9, 4. 35-4. 7及び5. 0-5. 3 (全18H, m), 6. 65 (1H, d, J=8. 3Hz), 6. 85-7. 5 (9H, m), 7. 6-7. 8 (1H, m)。

【1455】実施例642の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 2-1. 65, 1. 9-2. 25, 2. 6-3. 1, 3. 1-3. 35, 3. 4-3. 75, 4. 3-4. 6及び4. 9-5. 6 (全14H, m), 6. 62 (1H, d, J=8. 3Hz), 6. 85-7. 5 (9H, m), 7. 6-7. 8 (1H, m)。

【1456】実施例643の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 78-1. 06, 1. 14-2. 19, 2. 59-3. 30, 3. 40-4. 65及び4. 94-5. 16 [全21H, m, 3. 69 (s)], 6. 78-7. 75及び8. 56-8. 70 [全8H, m, 7. 45 (s)]。

【1457】実施例644の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 92 (6H, d, J=6. 71Hz), 1. 19-2. 32, 2. 55-4. 62及び4. 95-5. 16 (全12H, m), 6. 32-7. 95 [全9H, m, 7. 55 (s)]。

【1458】実施例645の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 31, 2. 52-4. 70及び4. 90-5. 15 [全14H, m, 3. 69 (s)], 6. 79-7. 81及び8. 55-8. 72 (全8H, m)。

【1459】実施例646の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 13-2. 35, 2. 62-4. 71及び4. 98-5. 19 [全16H, m, 3. 70 (s)], 6. 81-7. 92 [全7H, m, 7. 52 (d, J=2. 06Hz)]。

【1460】実施例649の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0. 98-4. 60及び4. 78-4. 90 (全13H, m), 6. 05-6. 21及び6. 40-8. 08 (全7H, m)。

【1461】実施例647の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 25-2. 32, 2. 60-3. 31, 3. 40-4. 68及び5. 05-5. 20 [全18H, m, 3. 69 (s)], 6. 58-7. 81 (8H, m)。

【1462】実施例648の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 05-2. 32, 2. 58-3. 90, 4. 00-4. 68及び5. 00-5. 18 [全18H, m, 3.

70 (s)], 6. 80-7. 64 (7H, m)。

【1463】実施例650の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2. 89 (2H, t, J=6Hz), 4. 35 (2H, t, J=6Hz), 7. 0 (1H, d, J=7Hz), 7. 2-7. 7 (10H, m), 7. 99 (1H, d, J=2. 5Hz)。

【1464】実施例651の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 33 (3H, t, J=7Hz), 3. 44 (2H, dt, J=6. 4Hz, J=2. 4Hz), 3. 98 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 6. 41 (1H, t, J=2. 4Hz), 6. 86 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 0 (1H, dd, J=8. 4Hz, J=2. 4Hz), 7. 35-7. 70 (10H, m)。

【1465】実施例652の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 8-2. 3 (2H, m), 2. 6-2. 8 (1H, m), 2. 8-3. 0 (1H, m), 3. 3-3. 56 (1H, m), 3. 85-4. 1 (2H, m), 4. 22 (2H, q, J=7Hz), 6. 69 (1H, d, J=8. 6Hz), 6. 89 (1H, dd, J=8. 6Hz, J=2. 4Hz), 7. 2-7. 7 (10H, m)。

【1466】実施例653の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 1-1. 7 (5H, m), 1. 7-2. 1 (5H, m), 2. 4-2. 75 (1H, m), 2. 85 (2H, t, J=6Hz), 4. 3 (2H, t, J=6Hz), 7. 0 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 19-7. 27 (3H, m), 7. 40-7. 45 (2H, m), 7. 96 (1H, d, J=2. 5Hz)。

【1467】実施例654の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2. 9 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 96 (3H, s), 4. 31 (2H, t, J=6. 4Hz), 6. 94-7. 1 (2H, m), 7. 35-7. 40 (2H, m), 7. 77 (1H, d, J=8. 3Hz), 8. 0 (1H, d, J=2. 5Hz)。

【1468】実施例655の化合物

$^1\text{H-NHR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 85-2. 05 (1H, m), 2. 15-2. 35 (1H, m), 2. 65 (1H, m), 2. 85 (1H, m), 3. 35-3. 55 (1H, m), 3. 85-4. 10 (2H, m), 6. 70 (1H, d, J=8. 6Hz), 6. 90 (1H, dd, J=8. 6Hz, J=2. 4Hz), 7. 25-7. 65 (10H, m)。

【1469】実施例656の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 1-1. 55 (5H, m), 1. 33 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 65-2. 0 (5H, m), 2. 45-2. 65 (1H, m), 3. 35-3. 5 (2H, m), 3. 94 (2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 4. 22 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 6. 40 (1H, t, $J=2.3\text{Hz}$), 6. 85 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7. 05 (1H, dd, $J=8.7\text{Hz}$, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 15 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7. 34 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7. 65 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$)。

【1470】実施例657の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 35-1. 60 (5H, m), 1. 70-2. 0 (6H, m), 2. 10-2. 35 (1H, m), 2. 35-2. 65 (1H, m), 2. 67 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 2. 90 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 3. 35-3. 55 (1H, m), 3. 85-4. 05 (2H, m), 6. 70 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6. 89 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 12 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7. 19 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 28 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$)。

【1471】実施例658の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 85-2. 10 (1H, m), 2. 15-2. 35 (1H, m), 2. 68 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=8\text{Hz}$), 2. 87 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=6.2\text{Hz}$), 3. 3-3. 5 (1H, m), 3. 75 (3H, s), 3. 8-4. 15 (2H, m), 6. 4-6. 55 (1H, m), 6. 88 (1H, dd, $J=8.6\text{Hz}$, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 20 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 54 (2H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 8. 16 (2H, d, $J=8.9\text{Hz}$)。

【1472】実施例659の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 85-2. 10 (1H, m), 2. 20-2. 40 (1H, m), 2. 71 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=8.4\text{Hz}$), 2. 94 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 3. 35-3. 55 (1H, m), 3. 85-4. 10 (2H, m), 6. 70 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 6. 90 (1H, dd, $J=8.6\text{Hz}$, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 21 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 7. 35-7. 70 (9H, m)。

【1473】実施例660の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 80-2. 0 (1H, m), 2. 10-2. 30 (1H, m), 2. 62 (1H, dd, $J=15.6\text{Hz}$,

$J=8.6\text{Hz}$), 2. 84 (1H, dd, $J=15.6\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 3. 3-3. 5 (1H, m), 3. 73 (3H, s), 3. 80-4. 10 (4H, m), 6. 50 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6. 67 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6. 89 (1H, dd, $J=8.7\text{Hz}$, $J=2.2\text{Hz}$), 7. 15-7. 35 (3H, m)。

【1474】実施例661の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 75-1. 95 (1H, m), 2. 10-2. 30 (1H, m), 2. 63 (1H, dd, $J=15.6\text{Hz}$, $J=8.4\text{Hz}$), 2. 85 (1H, dd, $J=15.6\text{Hz}$, $J=6.2\text{Hz}$), 3. 3-3. 5 (1H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 80-4. 05 (2H, m), 4. 61 (2H, s), 6. 6 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 6. 88 (1H, dd, $J=8.6\text{Hz}$, $J=2.2\text{Hz}$), 6. 95-7. 65, 8. 36 [全11H, m, 8. 36 (s)]。

【1475】実施例662の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 80-2. 10 (1H, m), 2. 15-2. 30 (1H, m), 2. 71 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=8\text{Hz}$), 2. 90 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 3. 3-3. 5 (1H, m), 3. 75-4. 10 (2H, m), 4. 60 (2H, s), 6. 59 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 6. 88 (1H, dd, $J=8.6\text{Hz}$, $J=2.2\text{Hz}$), 6. 97 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6. 99-7. 10 (1H, m), 7. 20 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7. 31-7. 39 (4H, m), 7. 54 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8. 38 (1H, s)。

【1476】実施例663の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 75-1. 95 (1H, m), 2. 10-2. 20 (1H, m), 2. 2 (3H, s), 2. 60 (1H, dd, $J=15.7\text{Hz}$, $J=8.6\text{Hz}$), 2. 83 (1H, dd, $J=15.7\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 3. 3-3. 4 (1H, m), 3. 78 (3H, s), 3. 8-4. 0 (2H, m), 4. 69 (2H, s), 6. 60 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6. 87 (2H, dt, $J=8.6\text{Hz}$, $J=2.2\text{Hz}$), 6. 94-7. 01 (1H, m), 7. 10-7. 50 (5H, m), 7. 64 (2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7. 74 (1H, s), 9. 60 (1H, s)。

【1477】実施例664の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 75-2. 00 (1H, m), 2. 15-2. 35 (1H, m), 2. 64 (1H, dd, $J=15.7\text{Hz}$, $J=8.6\text{Hz}$), 2. 86 (1H, dd, $J=15.7\text{Hz}$, $J=6\text{Hz}$), 3. 3-3. 5 (1H,

m), 3.75 (3H, s), 3.80-4.00 (2H, m), 4.72 (2H, s), 6.61 (1H, d, J=8.6Hz), 6.87 (1H, dd, J=8.8Hz, J=2.2Hz), 6.93-7.07 (2H, m), 7.17 (1H, d, J=2.2Hz), 7.25-7.50 (4H, m), 7.58 (2H, d, J=8.6Hz), 8.78 (1H, s)。

【1478】実施例665の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.80-2.05 (1H, m), 2.10-2.30 (1H, m), 2.71 (1H, dd, J=16Hz, J=8, 2Hz), 2.92 (1H, dd, J=16Hz, J=6Hz), 3.30-3.50 (1H, m), 3.75-4.10 (2H, m), 4.65 (2H, s), 6.55-7.65 [全11H, m, 6.60 (d, J=8.6Hz), 7.57 (d, J=8.6Hz)], 8.79 (1H, s)。

【1479】実施例666の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.80-2.0 (1H, m), 2.1-2.3 (1H, m), 2.36 (3H, s), 2.63 (1H, dd, J=15.6Hz, J=8.5Hz), 2.86 (1H, dd, J=15.6Hz, J=6Hz), 3.3-3.5 (1H, m), 3.74 (3H, s), 3.83-3.99 (2H, m), 4.59 (2H, s), 6.60 (1H, d, J=8.6Hz), 6.78 (2H, d, J=8Hz), 6.88 (2H, dd, J=8.6Hz, J=2Hz), 7.16-7.26 (2H, m), 7.38 (2H, d, J=8.7Hz), 7.55 (2H, d, J=8.7Hz), 8.36 (1H, s)。

【1480】実施例667の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.8-2.25, 2.65-4.10 (全10H, m), 4.68 (2H, s), 6.4-7.85 (全13H, m), 9.48 (1H, s)。

【1481】実施例668の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.8-3.0 (全7H, m), 3.25-3.50 (1H, m), 3.70-4.05 (2H, m), 4.56 (2H, s), 6.60 (1H, d, J=8.5Hz), 6.75-6.90 (4H, m), 7.18-7.26 (2H, m), 7.35 (2H, d, J=8.6Hz), 7.52 (2H, d, J=8.7Hz), 8.4 (1H, s)。

【1482】実施例669の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.9-2.25, 2.6-4.1, 4.3-4.75 [全15H, m, 0.99 (t, J=7.2Hz)], 6.8-7.5, 7.55-7.65, 8.2-8.5

[全13H, m, 7.60 (d, J=4Hz), 8.25 (d, J=4Hz)]。

【1483】実施例670の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.3-2.2, 2.35-2.5, 2.7-3.9及び4.4-4.65 [全15H, m, 2.40 (s), 3.73 (s)], 6.55 (0.6H, d, J=8.3Hz), 6.89 (1.3H, d, J=8.3Hz), 7.0-7.5 (全4H, m), 8.35-8.50 (0.8H, m), 8.9-9.05 (0.25H, m)。

【1484】実施例671の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.1-2.2, 2.7-3.4, 3.5-3.8及び4.45-4.65 [全12H, m, 3.69 (s)], 6.85-7.5及び8.9-9.1 (全8H, m)。

【1485】実施例672の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.4-2.3, 2.75-3.25及び4.75-5.05 (全8H, m), 6.75-7.45 (全7H, m), 9.55及び10.03 (全1H, 各s)。

【1486】実施例673の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-2.2, 2.6-3.85及び4.4-4.65 [全15H, m, 2.83 (s)], 6.21 (0.7H, dd, J=8.7Hz, J=2.5Hz), 6.51 (0.6H, d, J=2.5Hz), 6.6-7.4 (全5.7H, m)。

【1487】実施例674の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.0-2.1, 2.7-3.9, 4.4-5.3 [全17H, m, 1.1 (d, J=6Hz)], 6.0-6.1及び6.4-7.6 (全8H, m)。

【1488】実施例675の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.2-2.2, 2.7-4.0及び4.45-4.7 (全13H, m), 5.9及び6.9-7.7 [全8H, m, 5.9 (s)]。

【1489】実施例676の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.2-2.35, 2.75-3.10, 3.10-3.95及び4.4-4.6 [全16H, m, 2.79 (s)], 6.3-7.6 (全7H, m)。

【1490】実施例677の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.1-1.25, 1.25-2.2, 2.7-3.95及び4.45-4.65 (全22H, m), 6.85-7.8 (全7H, m), 7.8-8.5 (1H, m)。

【1491】実施例678の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 35-2. 05, 2. 65-4. 0及び4. 3-4. 65 [全15H, m, 4. 39 (s)], 5. 8-6. 85 (1H, m), 6. 85-8. 15 (全12H, m)。

【1492】実施例679の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 04-2. 20 [全7H, m, 1. 41 (t, $J=7.0\text{Hz}$)], 2. 32-3. 32, 3. 33-4. 30, 4. 43-4. 70及び5. 00-5. 22 (全13H, m, 2. 51 (s), 3. 72 (s)), 6. 43-7. 67 (11H, m)。

【1493】実施例680の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 03 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 0. 90-2. 30 (6H, m), 2. 38-3. 30, 3. 38-4. 36, 4. 43-4. 70及び5. 04-5. 23 [全13H, m, 2. 52 (s), 3. 72 (s), 3. 93 (t)], 6. 43-7. 64 (11H, m)。

【1494】実施例683の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 24-3. 02 (5H, m), 3. 04-3. 89, 3. 90-4. 88及び4. 93-5. 14 (全10H, m, 3. 71 (s), 3. 74 (s), 3. 76 (s), 3. 82 (s)), 6. 49-6. 65, 6. 71-6. 86, 6. 94-7. 10, 7. 11-7. 42及び7. 58-7. 78 (全6H, m)。

【1495】実施例684の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 12-2. 23, 2. 24-3. 93, 4. 01-4. 31, 4. 43-4. 70及び5. 01-5. 22 [全18H, m, 2. 37 (s), 2. 44 (s), 2. 53 (s), 2. 57 (s), 3. 72 (s)], 6. 47-7. 59 (11H, m)。

【1496】実施例685の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 11-2. 26 (4H, m), 2. 56-4. 32, 4. 45-4. 73及び5. 00-5. 20 [全8H, m, 3. 71 (s)], 6. 68-7. 81 (12H, m)。

【1497】実施例686の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 13-2. 37, 2. 42-4. 39, 4. 47-4. 75及び5. 04-5. 26 [全15H, m, 2. 56 (s), 3. 73 (s)], 6. 49-7. 95及び8. 13-8. 49 (全11H, m)。

【1498】実施例687の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) ppm:

1. 18-2. 27 (4H, m), 2. 28-4. 39, 4. 45-4. 72及び5. 03-5. 27 [全14H, m, 2. 35 (s), 2. 41 (s), 2. 52 (s), 2. 56 (s)], 6. 49-7. 64 (11H, m)。

【1499】実施例689の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1. 00-3. 76, 4. 28-4. 55及び4. 81-5. 05 [全15H, m, 2. 31 (s), 2. 44 (s)], 6. 49-7. 79 (11H, m), 12. 31 (1H, s)。

【1500】実施例690の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1. 04-2. 22 (4H, m), 2. 32-3. 76, 4. 27-4. 58及び4. 81-5. 08 (全8H, m), 6. 49-8. 48 (11H, m), 11. 97-12. 54 (1H, m)。

【1501】実施例691の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) ppm:
1. 02-3. 86, 4. 36-4. 62及び5. 01-5. 30 [全26H, m, 2. 41 (s), 3. 74 (s)], 6. 36-7. 40 (6H, m)。

【1502】実施例692の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2. 20-3. 01, 3. 32-4. 28及び4. 78-5. 49 [全23H, m, 2. 35 (s), 2. 44 (s), 3. 82 (s)], 6. 55-7. 75 (11H, m)。

【1503】実施例693の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 12-2. 05 (10H, m), 2. 19-2. 95, 3. 42-4. 25及び4. 75-5. 39 [全21H, m, 2. 35 (s)], 6. 59-7. 55 (7H, m)。

【1504】実施例696の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1. 48 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1. 57-2. 13 (2H, m), 2. 86-3. 13 (2H, m), 3. 36-3. 65 (1H, m), 4. 43-4. 63 (1H, m), 4. 70-4. 93 (1H, m), 6. 48-8. 00 (12H, m), 10. 19及び10. 46 (全1H, s), 12. 68 (1H, br s)。

【1505】実施例700の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 31 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1. 58 (3H, d, $J=6.7\text{Hz}$), 1. 51-2. 33 (2H, m), 2. 97-3. 23 (2H, m), 3. 40-3. 70 (1H, m), 3. 81-4. 18 (2H, m), 4. 25 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 4. 4

0-4.91 (1H, m), 4.73 (1H, q, J=6.7Hz), 6.51-7.65 (12H, m), 8.22 (1H, brs)。

【1506】実施例701の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.34 (3H, t, J=7.11Hz), 2.28-3.00 (2H, m), 3.71-5.12 (全6H, m), 6.85-7.65及び7.75-8.45 (全7H, m)。

【1507】実施例702の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (3H, t, J=7.12Hz), 2.32-2.90 (2H, m), 3.61-4.49 (全6H, m), 4.65-5.05 (2H, m), 6.10-7.68 (全7H, m)。

【1508】実施例703の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.22-1.43 (3H, m), 1.78-2.38 (2H, m), 2.99-3.24 (2H, m), 3.43-3.66 (1H, m), 3.78-4.39 (4H, m), 4.65-4.89 (1H, m), 6.67 (1H, dt, J=7.6, J=1.3Hz), 6.70 (1H, dd, J=8.2, J=1.3Hz), 6.89-6.99 (1H, m), 7.05 (1H, dd, J=7.3, J=1.7Hz), 7.37 (1H, d, J=8.4Hz), 7.81 (1H, dd, J=8.4, J=2.1Hz), 8.10 (1H, d, J=2.1Hz)。

【1509】実施例704の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (3H, t, J=7.16Hz), 1.50-1.81 [全3H, m, 1.59 (d, J=6.71Hz)], 2.50-2.95及び3.69-5.15 (全9H, m), 6.81-8.55 [13H, m, 7.55 (s), 8.26 (s)]。

【1510】実施例705の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.41-1.75 [全3H, m, 1.59 (d, J=6.76Hz)], 1.75-2.89, 3.60-4.48及び4.60-5.10 (全7H, m), 6.79-8.20及び8.36-8.88 (全12H, m)。

【1511】実施例706の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.72-1.10 (6H, m), 1.33 (3H, t, J=7.13Hz), 1.80-2.10, 2.55-2.90, 3.69-4.59及び4.75-5.05 [全11H, m, 7.29 (q, J=7.13Hz)], 6.71-7.85, 8.59-8.70 [全8H, m, 6.63 (s)]。

【1512】実施例707の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (3H, t, J=6.17Hz), 2.31-2.95及び3.39-5.10 (全12H, m), 6.72-7.89 (8H, m)。

【1513】実施例708の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.34 (3H, t, J=7.15Hz), 2.55-3.05, 3.70-4.61及び4.79-5.08 [全12H, m, 4.29 (q, J=7.15Hz), 4.46 (t, J=7.88Hz)], 6.81-7.72 (7H, m)。

【1514】実施例709の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 0.89 (6H, d, J=6.69Hz), 1.70-2.05, 2.30-4.20及び4.45-4.82 (全9H, m), 6.85-7.79, 8.10-8.20及び9.65-9.95 [全8H, m, 8.14 (s), 9.70 (s)]。

【1515】実施例710の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.05-5.05 (11H, m), 6.70-8.00 (7H, m)。

【1516】実施例711の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.99-1.98, 2.18-3.00及び3.64-4.01 [全18H, m, 2.34 (s)], 6.50-7.61及び8.40-8.73 (全8H, m)。

【1517】実施例712の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.43 (3H, s), 2.62-3.00, 3.71-4.20及び4.55-5.29 [全7H, m, 3.82 (s)], 6.62-7.65及び8.45-8.75 [全12H, m, 7.42 (d, J=8.45Hz)]。

【1518】実施例713の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.10-3.81及び4.81-5.35 [全21H, m, 2.37 (s)], 6.35-7.50 (7H, m)。

【1519】実施例714の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55-4.05及び4.85-5.25 [全13H, m, 2.46 (s), 3.81 (s)], 6.40-7.61 (11H, m)。

【1520】実施例715の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.04-2.01, 2.18-3.10, 3.56-4.49及び4.61-5.65 [全20H, m, 2.35 (s)], 6.51-7.65 (7H, m)。

【1521】実施例716の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.34 (3H, t, $J=7.08\text{Hz}$), 2.15–3.10, 3.61–4.51及び4.78–5.11 [全14H, m, 2.44 (s), 3.83 (s)], 6.61–7.58 (11H, m)。

【1522】実施例717の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.01–2.97, 3.51–4.28及び4.75–5.19 [全20H, m, 2.34 (s)], 6.40–7.70 (8H, m)。

【1523】実施例718の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2.29–2.94, 3.56–4.29及び4.75–5.08 [全12H, m, 2.43 (s), 3.82 (s)], 6.59–7.65 (7H, m), 8.55–9.07 (1H, m)。

【1524】実施例719の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.53 (9H, s), 2.51–2.96, 3.72–4.31及び4.51–5.18 (全6H, m), 6.85–7.62及び7.78–8.41 (全7H, m)。

【1525】実施例721

ジメチルスルフィド170mlに氷冷攪拌下塩化アルミニウム23.6gを徐々に添加し、続いて5-メトキシカルボニルメチル-1-[4-(2-フェノキシアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン16.76gのジクロロメタン150ml溶液を滴下し、その後室温で2時間攪拌した。反応混合物を濃塩酸-碎氷上に注ぎ込み、ジクロロメタン抽出を行なった。有機層を水洗後、硫酸マグネシウム乾燥、溶媒を濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:メタノール=30:1)にて精製して、13.67gの5-カルボキシメチル-1-[4-(2-フェノキシアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【1526】白色粉末状、
mp 102~106℃。

【1527】実施例722

7-クロロ-1-[2-メチル-4-(2-アセチルアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.48gをテトラヒドロフラン7mlに溶解し、これに5N-水酸化ナトリウム水溶液0.5mlを加え、室温で2時間攪拌した。反応液を2N塩酸により中和し、酢酸エチルにて抽出を行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過、濃縮した。得られた残渣にn-ヘキサン-酢酸エチル(1:1)を加え、洗浄、濾過し、得られた粉末を乾燥して、0.38

gの7-クロロ-1-[2-メチル-4-(2-ヒドロキシアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【1528】白色粉末状、
mp 194~195℃

実施例723

1-[2-メチル-4-(2-クロロアセチルアミノ)ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.8gをジメチルホルムアミド5mlに溶解し、これに炭酸カリウム0.47g、沃化ナトリウム0.51g及び5,6,7,8-テトラヒドロ-1-ナフトール0.40gを加え、60℃で3時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、飽和硫酸水素カリウム精製水、飽和食塩水で洗浄後硫酸マグネシウム乾燥後、濾過、濃縮した。得られた残渣を、1日放置し、ジクロロメタンにて洗浄し、濾過して粉末を乾燥して、1-[2-メチル-4-[2-(5-テトラヒドロナフチルオキシ)アセチルアミノ]ベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0.72gを得る。

【1529】白色粉末状、
mp 230–232℃ (分解)

適当な出発原料を用い、実施例723と同様にして前記実施例55~58、147、148、150~156、158~162、165~166、160、170、176~179、186~196、198、200~207、212、213、215、217、222~224、228~232、338~346、355~358、363、399~402、445~448、583、593、598、661~669、696~700及び704~705の化合物を得た。

【1530】実施例724

1-(4-アミノ-2-クロロベンゾイル)-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン1g、トリホスゲン0.3g及びo-ジクロロベンゼン10mlの混合物を130~140℃で4時間加熱攪拌した。トリエチルアミン0.8mlを加え、更に0.5時間攪拌し、再びトリエチルアミンを0.8ml追加し、更に0.5時間攪拌した。1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン0.38mlを加え、80℃にて1時間加熱攪拌した。ジクロロメタンにて希釈し、水、飽和食塩水洗浄後、硫酸マグネシウム上で乾燥した後、濾過、溶媒留去し、2.9gのオイルを得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;酢酸エチル-n-ヘキサン=1:1)で精製し、0.47gの1-[4-(2-テトラヒドロイソキノリルカルボニルアミノ)-2-クロロベンゾイル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンを得た。

【1531】無色不定形

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:

1. 35-2. 15, 2. 70-3. 10及び4. 80-5. 00 (全10H, m), 3. 66及び3. 76 (全2H, 各t, J=5. 8Hz), 4. 60及び4. 71 (全2H, 各s), 6. 70-7. 50 (12H, m)。

【1532】実施例725

1-(4-アミノ-2-クロロベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 8gのo-ジクロロベンゼン5ml溶液に、トリホスゲン0. 26gを加え、120℃で3時間攪拌した。ここで、トリエチルアミン0. 27gを加え、更に120℃で2時間攪拌した。その後、(4-ピリジル)メタノール0. 29gを加え、120℃で2時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、水で洗浄後有機層を硫酸マグネシウムで乾燥、濾過し、溶媒を濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液: 酢酸エチル: n-ヘキサン=1: 5→ジクロロメタン: メタノール=25: 1)にて精製後、残渣をメタノール-ジエチルエーテルで洗浄して1-[4-[(4-ピリジル)メトキシカルボニルアミノ]-2-クロロベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 45gを得た。

【1533】白色粉末状、mp 181-184℃。

【1534】実施例726

クロロホルム5mlにトリホスゲン0. 72gを加え、氷冷攪拌下、2-フェノキシエタノール1. 0gを内温が10℃以下になるようにして加え、0℃で1時間攪拌した。これに氷冷攪拌下、1-(4-アミノ-2-クロロベンゾイル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン1. 9g及びピペリジン2. 5gのクロロホルム30ml溶液を徐々に滴下した。その後室温にて3時間攪拌した。反応液を、飽和硫酸水素カリウム、精製水、飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過、溶媒を濃縮した。残渣をジエチルエーテルから再結晶を行ない、1-[4-(2-フェノキシエトキシカルボニルアミノ)-2-クロロベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン(1. 3g)を得た。

【1535】白色粉末状mp 144~146℃。

【1536】適当な出発原料を用い、実施例725及び726と同様にして前記実施例157、167、197、199、214、233、234、406、407、420、538、540、549、550、552、556、557、559、568、587、588、596、604、643、645、647、695、706、707及び709の化合物を得た。

【1537】実施例727

5-エトキシカルボニルメチル-1-[4-(2-クロロ

エトキシカルボニルアミノ)-2-クロロベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 5-ベンゾジアゼピン0. 9g、炭酸カリウム0. 40g及び沃化ナトリウム0. 43gのジメチルホルムアミド15ml混合物を80℃で8時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、水洗後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出液: ジクロロメタン: メタノール=30: 1)にて精製を行い、5-エトキシカルボニルメチル-1-[4-(2-オキソテトラヒドロオキサゾール-3-イル)-2-クロロベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 5-ベンゾジアゼピン0. 65gを得た。

【1538】無色不定形

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 34 (3H, t, J=7. 15Hz), 2. 55-3. 05, 3. 70-4. 61及び4. 79-5. 08 [全12H, m, 4. 29 (q, J=7. 15Hz, 4. 46 (t, J=7. 88Hz)], 6. 81-7. 72 (7H, m)。

【1539】適当な出発原料を用い、実施例727と同様にして前記実施例511、594、646、649、694及び710の化合物を得た。

【1540】実施例728

1-[4-(1-ピペラジニル)-2-クロロベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 25g、37%ホルムアルデヒド0. 45g及び水素化シアノホウ素ナトリウム0. 12gのメタノール5ml混合物に、氷冷攪拌下、酢酸0. 12gを加え、室温で1時間攪拌した。反応液に、酢酸エチルを加え、2N水酸化ナトリウム、精製水にて洗浄後、有機層を硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(溶出液: ジクロロメタン: メタノール=10: 1)にて精製し、1-[4-(4-メチル-1-ピペラジニル)-2-クロロベンゾイル]-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン0. 10gを得た。

【1541】白色粉末状、mp 138-140℃。

【1542】実施例728と同様にして適当な出発原料を用いて、前記実施例416、417、457、515、523、524、677及び678の化合物を得る。

【1543】実施例729

1-[4-ニトロ-2-クロロベンゾイル]-1, 5-ベンゾジアゼピン5g及びブromo酢酸エチル16. 7mlをアセトニトリル100mlに溶解し、1. 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン11. 3mlを徐々に滴下した。混合物を2日間、加熱還流後、濃縮し、水、クロロホルムを加えて抽出し、炭酸ナトリ

ウムにて乾燥シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；n-ヘキサン：酢酸エチル＝4：1→1：1）にて精製し、1-（4-ニトロ-2-クロロベンゾイル）-5-エトキシカルボニルメチル-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 5-ベンゾジアゼピン4.4gを得た。

【1544】淡黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.22-1.43 (3H, m), 1.78-2.38 (2H, m), 2.99-3.24 (2H, m), 3.43-3.66 (1H, m), 3.78-4.39 (4H, m), 4.65-4.89 (1H, m), 6.67 (1H, dt, $J=7.6$, $J=1.3\text{Hz}$), 6.70 (1H, dd, $J=8.2$, $J=1.3\text{Hz}$), 6.89-6.99 (1H, m), 7.05 (1H, dd, $J=7.3$, $J=1.7\text{Hz}$), 7.37 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.81 (1H, dd, $J=8.4$, $J=2.1\text{Hz}$), 8.10 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$)。

【1545】適当な出発原料を用い、実施例729と同様にして前記実施例692～702、704～710及び715～720の化合物を得た。

【1546】実施例730

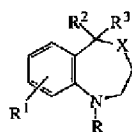
5-シアノメチル-1-（4-フェニル-2-クロロベンゾイル）-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピン1g、塩化アンモニウム0.4g及びナトリウムアジド0.48gをジメチルホルムアミド10mlに懸濁し、110～120℃で16時間加熱した。更に塩化アンモニウム0.4g及びナトリウムアジド0.48gを追加し、16時間加熱した。ジメチルホルムアミドを減圧留去し、1N塩酸を加えて酸性とし、クロロホルム抽出した。有機層を水洗し、硫酸マグネシウム乾燥後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製（溶出液；ジクロロメタン→ジクロロメタン：メタノール＝20：1）し、得られた油状物にジエチルエーテルを加えて結晶化すると、5-（5-テトラゾリル）メチル-1-（4-フェニル-2-クロロベンゾイル）-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾアゼピンが白色粉末状として0.9g得られた。

【1547】mp 191～194℃。

【1548】適当な出発原料を用い、実施例1及び2と同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【1549】

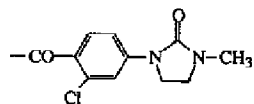
【表413】



実施例 731

構造

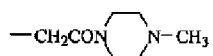
R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² :



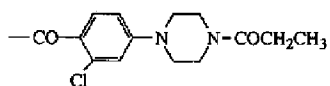
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 732

構造

R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : メタノール・ジエチルエーテル
融点 : 136 - 138℃
形態 : 遊離

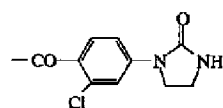
【1550】

【表414】

実施例 733

構造

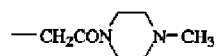
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

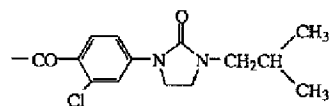
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 734

構造

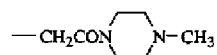
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

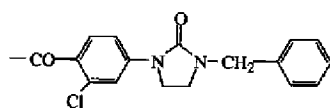
【1551】

【表415】

実施例 735

構造

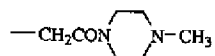
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



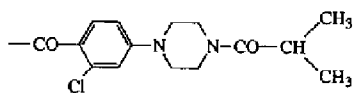
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 736

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

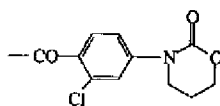
【1552】

【表4-16】

実施例 737

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

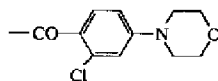
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール洗淨
融点 : 196 - 198℃
形態 : 遊離

実施例 738

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル- n-ヘキサン
融点 : 124 - 126℃
形態 : 遊離

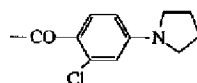
【1553】

【表417】

実施例 739

構造

R :



X :



R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール

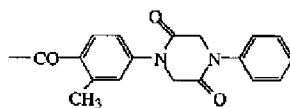
融点 : 160 - 162℃

形態 : 遊離

実施例 740

構造

R :



X :



R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

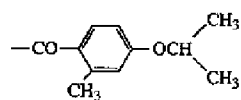
【表 4 1 8】

【 1 5 5 4】

実施例 741

構造

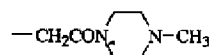
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

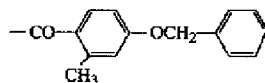
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 742

構造

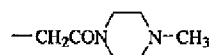
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

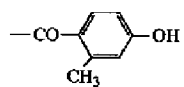
【1555】

【表419】

実施例 743

構造

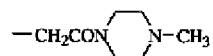
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

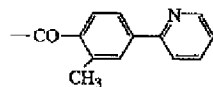
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 744

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン

形態 : 遊離

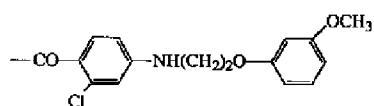
【表 4-20】

【1556】

実施例 745

構造

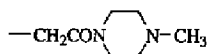
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

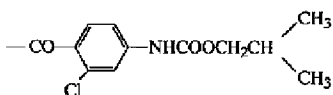
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 746

構造

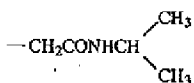
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : n-ヘキサン・酢酸エチル

融点 : 162 - 164℃

形態 : 遊離

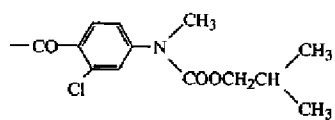
【1557】

【表421】

實施例 747

構造

R :

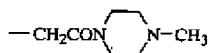


X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

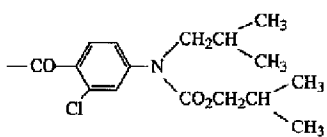
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 748

構造

R :

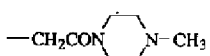


X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

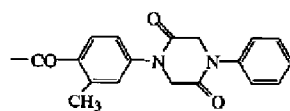
【表 4-2-2】

【1558】

実施例 749

構造

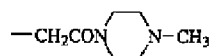
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

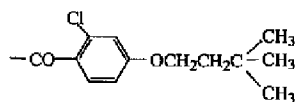
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 750

構造

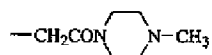
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 118 - 119℃

形態 : 遊離

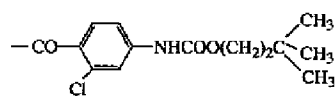
【1559】

【表423】

実施例 751

構造

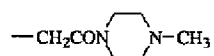
R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² :



R³ : H

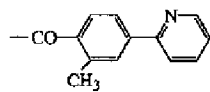
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 752

構造

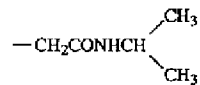
R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

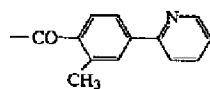
【1560】

【表424】

実施例 753

構造

R :

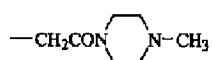


X :



R¹ : H

R² :



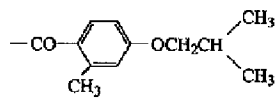
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 754

構造

R :

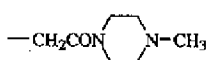


X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

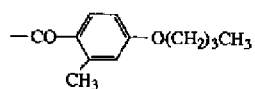
【表 4 2 5】

【 1 5 6 1 】

实施例 755

構造

R :

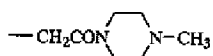


X :



R¹ : H

R² :



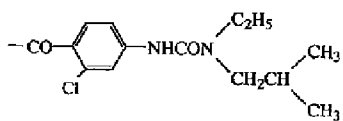
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 756

構造

R :



X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 2HCl

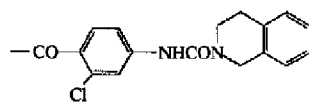
【1562】

【表426】

実施例 757

構造

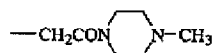
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



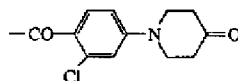
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : エタノール
融点 : 201.5 - 204℃
形態 : HCl

実施例 758

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄
融点 : 120 - 122℃
形態 : 遊離

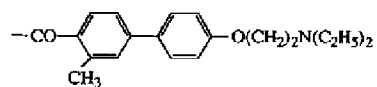
【表 4.2.7.】

【1563】

実施例 759

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

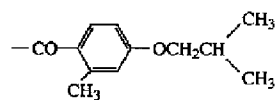
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 760

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

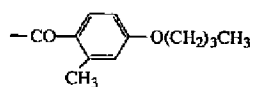
【 1 5 6 4 】

【 表 4 2 8 】

実施例 761

構造

R :

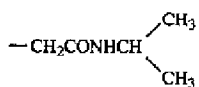


X :



R¹ : H

R² :



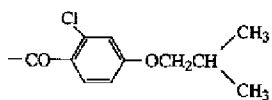
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 762

構造

R :

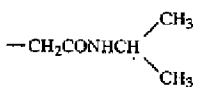


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 147 - 148℃
形態 : 遊離

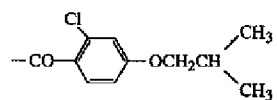
【1565】

【表429】

実施例 763

構造

R :

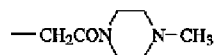


X :



R1 : 7-Cl

R2 :



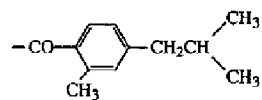
R3 : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル
融点 : 178 - 179℃
形態 : 遊離

実施例 764

構造

R :

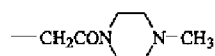


X :



R1 : H

R2 :



R3 : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

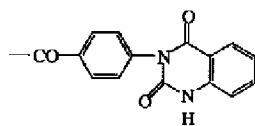
【 1 5 6 6 】

【 表 4 3 0 】

実施例 765

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色鱗片状

再結晶溶媒 : メタノール-クロロホルム-ジエチルエーテル

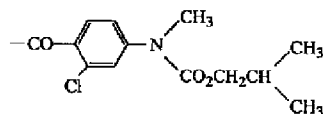
融点 : 300℃以上

形態 : 遊離

実施例 766

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

形態 : 遊離

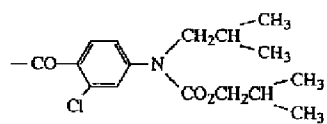
【1567】

【表431】

実施例 767

構造

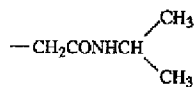
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

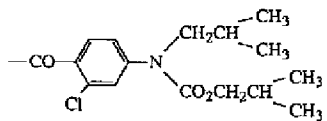
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 768

構造

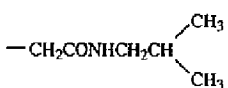
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

形態 : 遊離

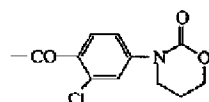
【表 4 3 2】

【1 5 6 8】

實施例 769

構造

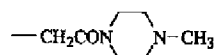
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

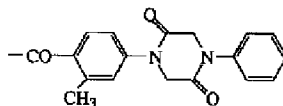
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 770

構造

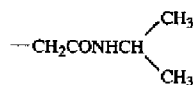
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

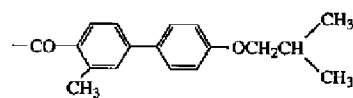
【1569】

【表433】

実施例 771

構造

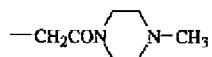
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

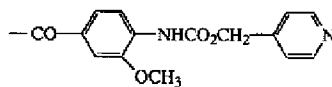
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 772

構造

R :



X : H

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

融点 : 130 - 133℃

形態 : 遊離

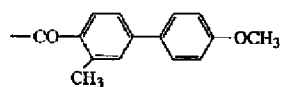
【1570】

【表434】

実施例 773

構造

R :

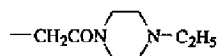


X :



R¹ : H

R² :



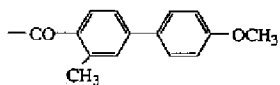
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 774

構造

R :



X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

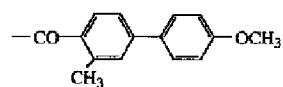
【1571】

【表435】

実施例 775

構造

R :

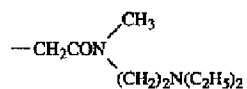


X :



R¹ : H

R² :



R³ : H

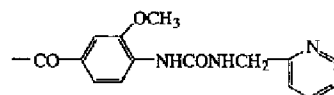
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 776

構造

R :



X :



R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 174.5 - 175.5℃

形態 : 遊離

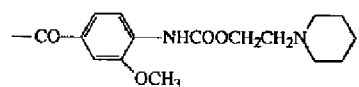
【1572】

【表436】

實施例 777

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

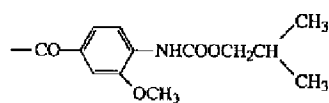
R³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

實施例 778

構造

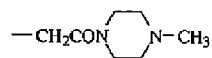
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

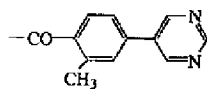
【1573】

【表437】

実施例 779

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

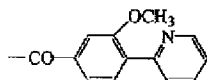
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 780

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

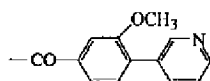
【1574】

【表438】

実施例 781

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

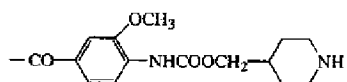
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 782

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

融点 : 123 - 125℃

形態 : 遊離

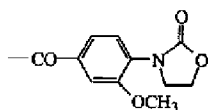
【表 4 3 9】

【1 5 7 5】

実施例 783

構造

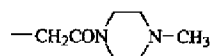
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



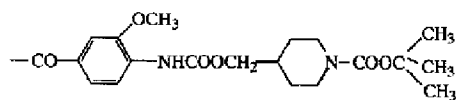
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 784

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

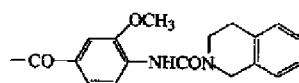
【表 4 4 0】

【1 5 7 6】

实施例 785

構造

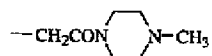
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



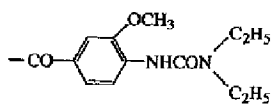
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

实施例 786

構造

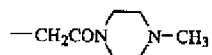
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

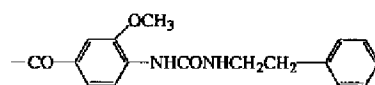
【1577】

【表441】

實施例 787

構造

R :

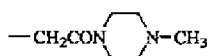


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

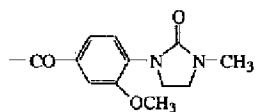
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

實施例 788

構造

R :

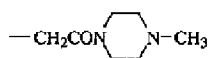


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 游離

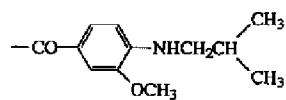
【 1 5 7 8 】

【 表 4 4 2 】

実施例 789

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



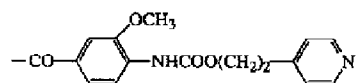
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 790

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

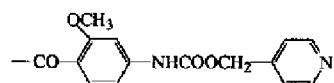
【1579】

【表443】

实施例 791

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R1 : 7-Cl

R2 : H

R3 : H

結晶形 : 黄色粉末状

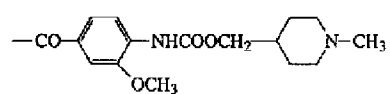
融点 : 135 - 139℃

形態 : 遊離

实施例 792

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R1 : 7-Cl

R2 : H

R3 : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

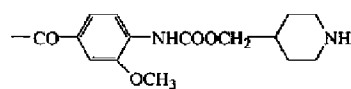
【1580】

【表444】

実施例 793

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル洗浄

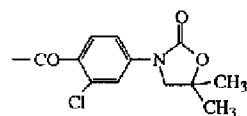
融点 : 123 - 125℃

形態 : 遊離

実施例 794

構造

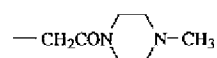
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

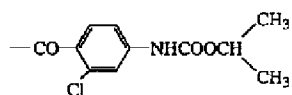
【表 4 4 5】

【 1 5 8 1 】

実施例 795

構造

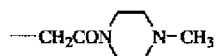
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 796

構造

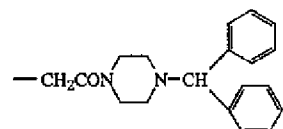
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

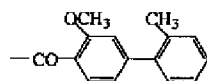
【1582】

【表446】

実施例 797

構造

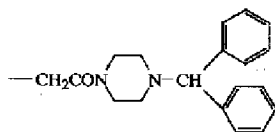
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



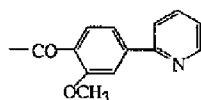
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 798

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル
形態 : 遊離

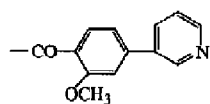
【1583】

【表447】

実施例 799

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色粉末状

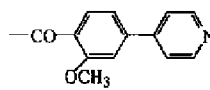
再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : 遊離

実施例 800

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : H

R³ : H

結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

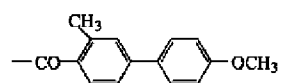
【1584】

【表448】

実施例 801

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

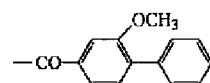
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 802

構造

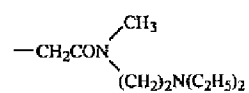
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

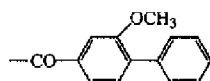
【 1 5 8 5 】

【 表 4 4 9 】

実施例 803

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

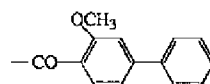
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

実施例 804

構造

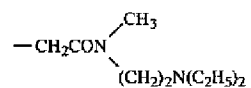
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

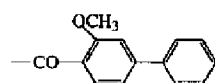
【 1 5 8 6 】

【 表 4 5 0 】

实施例 805

構造

R :



X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ :

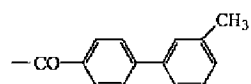
H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

实施例 806

構造

R :

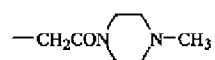


X :



R¹ : 7-Cl

R² :



R³ :

H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

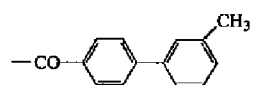
【1587】

【表451】

实施例 807

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

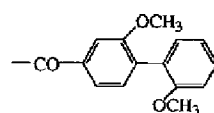
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

实施例 808

構造

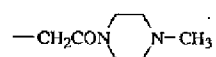
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

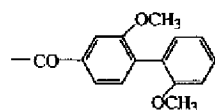
【1588】

【表4-5-2】

實施例 809

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

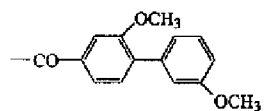
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

實施例 810

構造

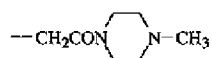
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

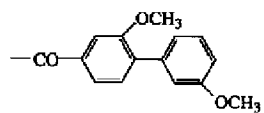
【 1 5 8 9 】

【 表 4 5 3 】

実施例 811

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$

R³ : H

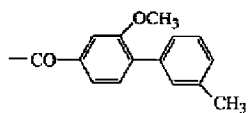
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 812

構造

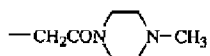
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

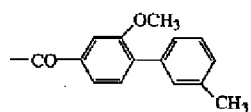
【1590】

【表454】

実施例 813

構造

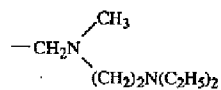
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² :



R³ : H

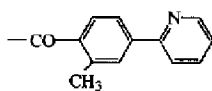
結晶形 : 無色不定形

形態 : HCl

実施例 814

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : クロロホルム-ジエチルエーテル

形態 : HCl

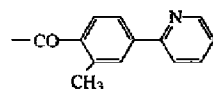
【表 4.5.5】

【1591】

実施例 815

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$

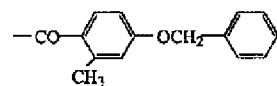
R³ : H

形態 : HCl

実施例 816

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

形態 : 遊離

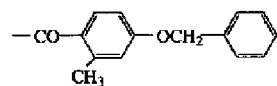
【1592】

【表456】

実施例 817

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

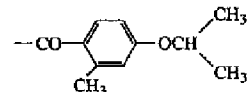
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 818

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 黄色粘稠油

形態 : 遊離

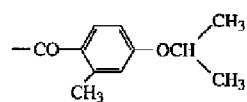
【1593】

【表457】

実施例 819

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

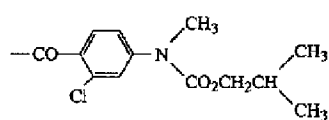
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 820

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 淡黄色油状
形態 : 遊離

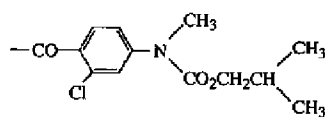
【1594】

【表458】

實施例 821

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

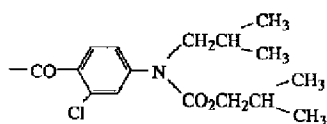
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 822

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 淡黃色油狀
形態 : 遊離

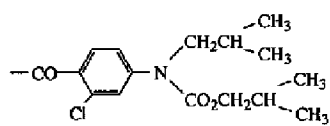
【表 4.5.9】

【1595】

實施例 823

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

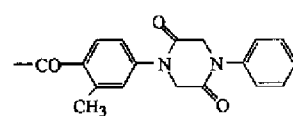
結晶形 : 淡黃色不定形

形態 : 遊離

實施例 824

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

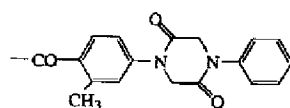
【表 4-6-0】

【1596】

實施例 825

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

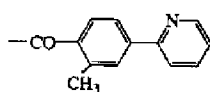
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 826

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : HCl

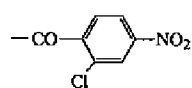
【1597】

【表461】

實施例 827

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CN}$

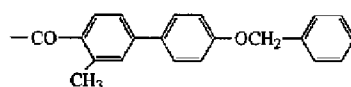
R³ : H

結晶形 : 白色粉末狀
形態 : 遊離

實施例 828

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

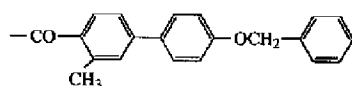
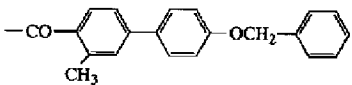
R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末狀
形態 : 遊離

【1598】

【表462】

实施例 829	
構造	
R :	
X :	-CH ₂ -
R ¹ :	H
R ² :	H
R ³ :	H
結晶形	: 淡黄色粉末状
形態	: 遊離
实施例 830	
構造	
R :	
X :	-CH ₂ -
R ¹ :	H
R ² :	-CH ₂ COOH
R ³ :	H
結晶形	: 白色粉末状
融点	: 170℃
形態	: 遊離

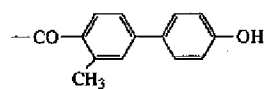
【1599】

【表463】

実施例 831

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

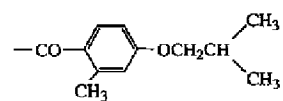
融点 : 177 - 178℃

形態 : 遊離

実施例 832

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 87 - 89℃

形態 : 遊離

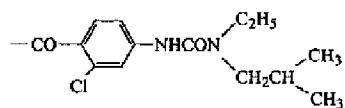
【1600】

【表464】

实施例 833

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

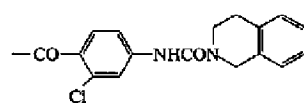
R³ : H

結晶形 : 微黄色不定形
形態 : 遊離

实施例 834

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

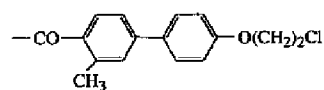
【1601】

【表465】

实施例 835

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : H

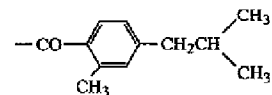
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

实施例 836

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

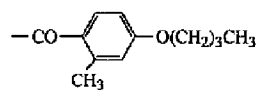
R³ : H

結晶形 : 黄色油状物
形態 : 遊離

実施例 837

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

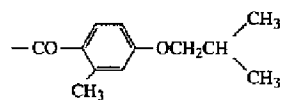
融点 : 99 - 101℃

形態 : 遊離

実施例 838

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

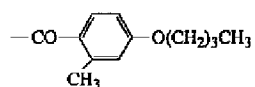
形態 : 遊離

【表467】

實施例 839

構造

R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² : —CH₂COOH

R³ : H

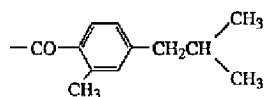
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 840

構造

R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² : —CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

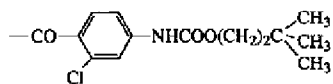
【表 4 6 8】

【1604】

實施例 841

構造

R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² : —CH₂COOCH₃

R³ : H

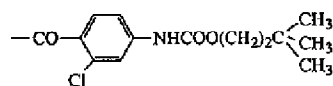
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 842

構造

R :



X : —CH₂—

R¹ : H

R² : —CH₂COOH

R³ : H

結晶形 : 淡黃色粉末狀

形態 : 遊離

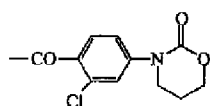
【表 4 6 9】

【1605】

实施例 843

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

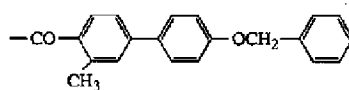
結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

实施例 844

構造

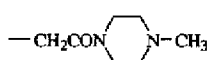
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

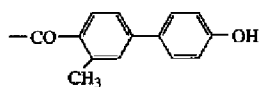
【1606】

【表470】

実施例 845

構造

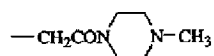
R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² :



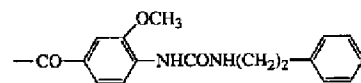
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 846

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : アセトン
融点 : 185 - 187℃
形態 : 遊離

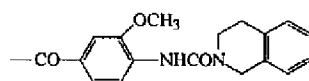
【1607】

【表471】

実施例 847

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

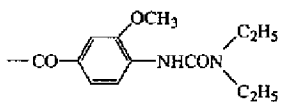
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 : 148.5 - 150.5℃
形態 : 遊離

実施例 848

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン
融点 : 160 - 162℃
形態 : 遊離

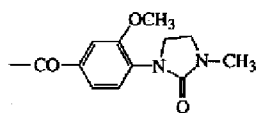
【1608】

【表472】

实施例 849

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

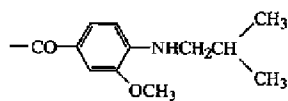
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

实施例 850

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 黄色油状
形態 : 遊離

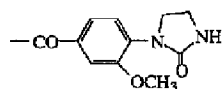
【1609】

【表473】

実施例 851

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

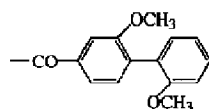
結晶形 : 微黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 852

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

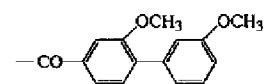
【1610】

【表474】

実施例 853

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

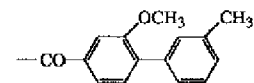
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 854

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

R³ : H

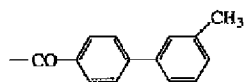
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 855

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

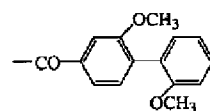
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 856

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

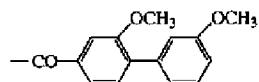
形態 : 遊離

【表476】

実施例 857

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

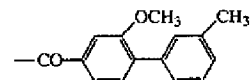
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

実施例 858

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

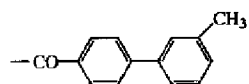
【1613】

【表477】

実施例 859

構造

R :

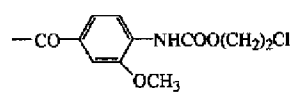
X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

実施例 860

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : 7-ClR² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$ R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

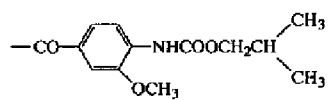
【1614】

【表478】

實施例 861

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$

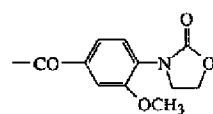
R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

實施例 862

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

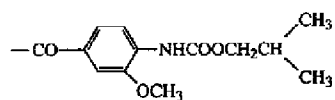
【 1 6 1 5 】

【 表 4 7 9 】

實施例 863

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

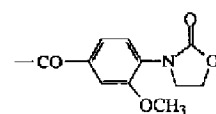
結晶形 : 白色粉末狀

形態 : 遊離

實施例 864

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : 7-Cl

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 白色粉末狀

形態 : 遊離

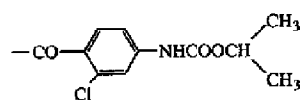
【1616】

【表480】

實施例 865

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

R³ : H

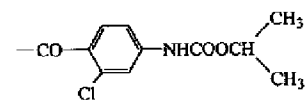
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

實施例 866

構造

R :



X : $-\text{CH}_2-$

R¹ : H

R² : $-\text{CH}_2\text{COOH}$

R³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

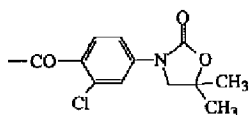
【1617】

【表481】

実施例 867

構造

R :

X : $-\text{CH}_2-$ R¹ : HR² : $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ R³ : H

結晶形 : 白色粉末状

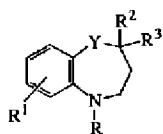
再結晶溶媒 : ジエチルエーテルより再結晶

形態 : 遊離

【1618】 適当な出発原料を用い、実施例1及び2と
同様にして下記表に記載の化合物を得た。

【1619】

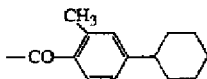
【表482】



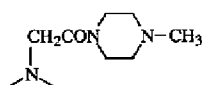
実施例 868

構造

R :



Y :

R¹ : HR² : HR³ : H

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

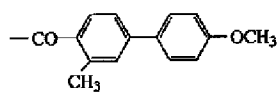
【1620】

【表483】

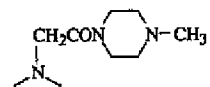
實施例 869

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² : H

R³ : H

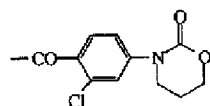
結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

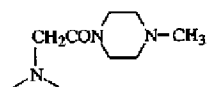
實施例 870

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形

形態 : 遊離

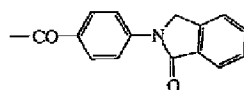
【表 4-8-4】

【1621】

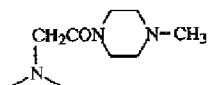
実施例 871

構造

R :



X :



R¹ : H

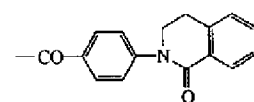
R² 及び R³ : =O

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

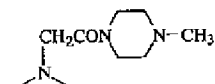
実施例 872

構造

R :



X :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状
融点 : 168 - 171℃
形態 : 遊離

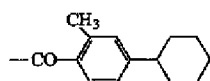
【 1 6 2 2 】

【 表 4 8 5 】

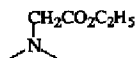
实施例 873

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² : H

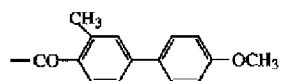
R³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

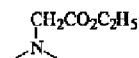
实施例 874

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 褐色不定形
形態 : 遊離

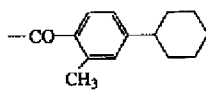
【1623】

【表486】

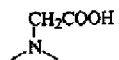
实施例 875

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² : H

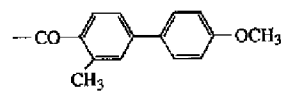
R³ : H

結晶形 : 白色粉末状
形態 : 遊離

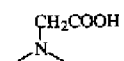
实施例 876

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² : H

R³ : H

結晶形 : 無色不定形
形態 : 遊離

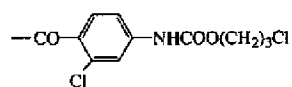
【表 4.8.7】

【1624】

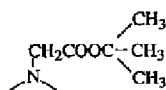
实施例 877

構造

R :



Y :



R¹ : H

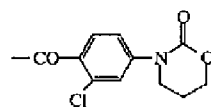
R² 及び R³ : =O

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

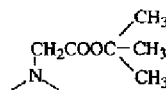
实施例 878

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 黄色不定形
形態 : 遊離

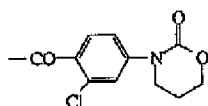
【1625】

【表488】

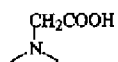
実施例 879

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

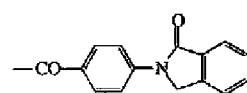
結晶形 : 褐色不定形

形態 : 遊離

実施例 880

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

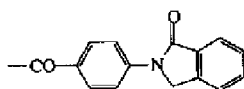
【1626】

【表489】

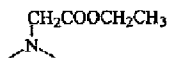
実施例 881

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

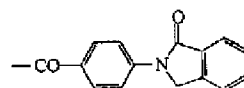
結晶形 : 褐色油状

形態 : 遊離

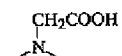
実施例 882

構造

R :



Y :



R¹ : H

R² 及び R³ : =O

結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

【1627】

【表490】

実施例 883	
構造	
R :	
Y :	
R ¹ :	H
R ² 及び R ³ :	=O
結晶形	: 褐色不定形
形態	: 遊離

実施例 884	
構造	
R :	
Y :	
R ¹ :	H
R ² 及び R ³ :	=O
結晶形	: 褐色不定形
形態	: 遊離

【1628】

【表491】

実施例 885	
構造	
R :	
Y :	
R ¹ :	H
R ² 及び R ³ :	=O
結晶形	: 褐色粉末状
再結晶溶媒	: ジエチルエーテル洗浄
形態	: 遊離

【1629】上記で得られる各実施例化合物のNMRスペクトルは、次の通りである。

【1630】実施例731の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.25-4.30及び4.6-4.85 [全27H, m, 2.49 (s), 2.84 (s), 2.94 (s)], 6.85-8.0 (全7H, m)。

【1631】実施例733の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm : 1.1-2.1, 2.4-4.1及び4.1-4.

7 (全24H, m), 6.7-7.8, 7.8-8.0及び8.35-8.7 (全7H, m), 11.1-11.7 (1H, m)。

【1632】実施例734の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm : 0.81-2.20, 2.6-4.0及び4.2-4.6 (全33H, m), 6.8-8.0 (全7H, m), 10.8-11.3 (1H, m)。

【1633】実施例735の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm

m: 1. 1-2. 2, 2. 6-4. 1及び4. 3-4. 6 (全26H, m), 6. 8-7. 9 [全12H, m, 7. 63 (s), 7. 93 (s)], 10. 8-11. 4 (1H, m)。

【1634】実施例736の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 99-2. 20, 2. 63-3. 91及び4. 81-5. 08 [全23H, m, 1. 12 (d, $J=6. 8\text{ Hz}$)], 6. 48 (1H, dd, $J=8. 6\text{ Hz}$, 8. 5Hz), 6. 71-7. 48 (6H, m)。

【1635】実施例740の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 35-1. 80, 1. 80-2. 25, 2. 35-2. 60, 2. 60-3. 15, 3. 25-3. 55, 4. 35-4. 65及び4. 85-5. 05 [全15H, m, 2. 46, 4. 43及び4. 48 (各s)], 6. 52-6. 65, 6. 78-6. 95及び7. 12-7. 55 (全11H, m)。

【1636】実施例741の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 08-1. 88 [9H, m (1. 22及び1. 35, 各3H, 各d, $J=6. 0\text{ Hz}$)], 1. 88-2. 61 [11H, m (2. 33及び2. 43, 各s)], 2. 61-4. 04, 4. 31-4. 70及び4. 98-5. 19 (全10H, m), 6. 12-7. 43 (7H, m)。

【1637】実施例742の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 10-2. 59 [15H, m (2. 33及び2. 45, 各s)], 2. 59-3. 09 (2H, m), 3. 09-4. 01及び4. 43-4. 64 (全6H, m), 4. 93及び5. 09 (全2H, 各s), 6. 24-7. 51 (12H, m)。

【1638】実施例743の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 08-2. 61 [15H, m, 2. 34 (s)], 2. 61-3. 02 (2H, m), 3. 02-4. 11, 4. 43-4. 64及び4. 90-5. 12 (全6H, m), 5. 30 (1H, s), 6. 00-7. 45 (7H, m)。

【1639】実施例744の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 32-2. 26, 2. 45-2. 65, 2. 65-3. 30及び4. 85-5. 12 [全11H, m, 2. 53 (s)], 6. 65-6. 75, 6. 75-7. 06, 7. 06-7. 54, 7. 54-7. 96及び8. 58-8. 76 (全11H, m)。

【1640】実施例745の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1. 0-2. 2及び2. 7-4. 8 (全28H,

m), 6. 15-7. 35 (11H, m), 10. 3-10. 95 (1H, m)。

【1641】実施例747の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 75-1. 00, 1. 15-2. 35, 2. 35-4. 27及び4. 45-4. 80 [全32H, m, 3. 38 (s)], 6. 75-7. 55 (7H, m), 12. 6-13. 4 (1H, br)。

【1642】実施例748の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 66-1. 10, 1. 10-1. 49, 1. 49-2. 34, 2. 34-4. 23及び4. 35-4. 80 (全38H, m), 6. 73-7. 55 (7H, m), 12. 6-13. 5 (1H, br)。

【1643】実施例749の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 75-0. 96, 0. 96-2. 22, 2. 22-4. 30及び4. 30-4. 83 [全27H, m, 4. 58及び2. 49 (各s)], 6. 48-7. 53 (11H, m), 12. 75-13. 45 (1H, br)。

【1644】実施例751の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 78-1. 05, 1. 15-4. 30及び4. 42-4. 75 [全33H, m, 0. 93, 0. 99及び2. 33 (各s)], 6. 68-7. 89 (8H, m)。

【1645】実施例752の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 52 (3H, d, $J=6. 6\text{ Hz}$), 0. 97 (3H, d, $J=6. 6\text{ Hz}$), 1. 10-2. 20, 2. 20-3. 20及び3. 35-4. 15 [全13H, m, 2. 62 (s)], 6. 35-6. 55, 7. 00-7. 60及び7. 60-8. 05 (全10H, m), 8. 65-8. 80 (1H, m)。

【1646】実施例753の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 25-2. 45, 2. 45-4. 30及び4. 30-4. 90 (全23H, m), 6. 45-8. 55 (全11H, m), 8. 75-9. 00 (1H, m)。

【1647】実施例754の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 82-1. 14 [6H, m, (0. 95及び1. 04, 各d, $J=6. 7\text{ Hz}$)], 1. 15-1. 93 (1H, m), 1. 95-2. 59 [14H, m, 2. 33及び4. 45 (各s)], 2. 59-4. 02, 4. 45-4. 67及び4. 98-5. 17 (全11H, m), 6. 12-7. 46 (7H, m)。

【1648】実施例755の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 92及び0. 99 (全6H, 各t, $J=7. 3$

H₂), 1.19-2.59 [18H, m, 12.33 及び2.44 (各s)], 2.59-4.09, 4.41-4.65及び4.95-5.18 [全11H, m, 3.83及び3.98 (各t, J=6.5H₂)], 6.11-7.45 (7H, m)。

【1649】実施例756の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 0.7-0.95, 0.95-2.25, 2.60-4.20及び4.20-4.55 [全34H, m, 0.8 (d, J=6.6H₂), 2.66 (s)], 6.75-7.95, 8.29及び8.57 (全8H, m, 7.62, 7.83, 8.29及び8.57 (各s))。

【1650】実施例759の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1.09-2.19 [12H, m, 1.25 (t, J=7.2H₂)], 2.28-3.67, 4.24-4.57及び4.68-4.98 [全10H, m, 2.41 (s)], 6.68-7.81 (11H, m), 10.26-10.64 (1H, m)。

【1651】実施例760の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.50及び0.95 (全6H, 各d, J=6.5H₂), 1.01-1.32 [7H, m, 1.04 (3H, d, J=6.7H₂)], 1.48-3.18 [10H, m, 2.49 (s)], 3.30-4.65及び5.46-5.72 [全5H, m, 3.75 (d, J=6.5H₂)], 6.40-7.39 (8H, m)。

【1652】実施例761の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.50 (3H, d, J=6.5H₂), 0.85-1.29 [7H, m, 0.95 (3H, d, J=6.5H₂)], 0.99及び1.16 (全3H, 各t, J=5.5H₂), 1.35-2.18 (10H, m), 2.19-2.58 [5H, m, 2.49 (s)], 2.58-2.78及び2.89-3.18 (全2H, m), 3.30-4.65及び5.41-5.67 (全6H, m), 6.81-7.40 (8H, m)。

【1653】実施例764の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 0.64-2.12 [11H, m, 0.75及び0.89 (各d, 各J=6.5H₂)], 2.12-5.05 [21H, m, 2.33 (s)], 6.37-7.52 (7H, m), 10.92-11.43 (1H, m)。

【1654】実施例765の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃+DMSO-d₆) δ ppm: 1.2-2.3 (4H, m), 2.5-3.4, 4.7-5.1及び5.3-5.6 (全4H, 各m), 6.5-7.5 (9H, m), 7.60

(1H, dd, J=7.5H₂, 7.5H₂), 7.95 (1H, d, J=7.5H₂), 11.43 (1H, s)。

【1655】実施例766の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.50 (3H, d, J=6.6H₂), 0.76-1.40, 1.50-2.18, 2.18-2.70及び2.70-4.18 [全24H, m, 3.36 (s)], 6.28-6.42及び6.82-7.54 (全8H, m)。

【1656】実施例767の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.50 (3H, d, J=6.6H₂), 0.69-1.05, 1.05-1.41, 1.41-2.19, 2.19-2.70及び2.95-4.15 (全31H, m), 6.27-6.38及び6.75-7.52 (8H, m)。

【1657】実施例768の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.55-0.65, 0.72-0.99, 1.20-1.44, 1.55-2.10, 2.10-2.90, 2.90-3.25及び3.25-4.10 (全36H, m), 6.30-6.45, 6.75-6.94及び7.00-7.50 (8H, m)。

【1658】実施例769の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.05-4.70及び4.89-5.12 (全26H, m, 2.34 (s), 4.33 (t, J=5.4H₂), 4.40 (t, J=5.3H₂), 6.72-7.70 (7H, m)。

【1659】実施例770の化合物

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.61 (3H, d, J=6.6H₂), 0.97 (3H, d, J=6.6H₂), 1.15-1.30, 1.55-2.15, 2.25-2.70, 2.90-3.20, 3.32-3.52及び3.60-3.95 (全19H, m), 4.40-4.60 (4H, m), 6.20-6.40, 6.51-6.52及び6.82-7.55 (全13H, m)。

【1660】実施例771の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 0.82-2.25 (11H, m, 0.97 (d, J=6.6H₂), 2.29-4.98 [21H, m, 2.43 (s)], 6.49-7.79 (11H, m), 10.85-11.30 (1H, m)。

【1661】実施例773の化合物

¹H-NMR (200MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1.00-2.30 [7H, m, 1.28 (t, J=7.2H₂)], 2.31-5.08 [21H, m, 2.43 (s), 3.76 (s)], 6.48-7.8

1 (11H, m), 10.81-11.31 (1H, m)。

【1662】実施例774の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1.01-2.38 (4H, m), 2.39-5.02 [24H, m, 2.43 (s), 3.76 (s), 3.81 (s)], 6.49-7.78 (11H, m), 10.47-11.08 (1H, m)。

【1663】実施例775の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1.01-2.28 [10H, m, 1.19 (t, $J=7.1\text{Hz}$)], 2.29-5.02 [22H, m, 2.44 (s), 3.77 (s), 3.81 (s)], 6.49-7.81 (11H, m), 9.92-10.32 (1H, m)。

【1664】実施例777の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.21-3.18, 3.58-3.85, 4.15-4.40及び4.82-5.15 [全25H, m, 2.63 (t, $J=5.73\text{Hz}$), 4.27 (t, $J=5.8\text{Hz}$)], 6.14-7.01, 7.18-7.49及び7.75-7.92 [全7H, m, 7.85 (d, $J=8.5\text{Hz}$)]。

【1665】実施例778の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.96 (6H, d, $J=10.7\text{Hz}$), 1.21-4.11, 4.31-4.59及び5.01-5.22 [全21H, m, 2.41 (s), 3.70 (s), 3.92 (d, $J=6.6\text{Hz}$)], 6.49-7.67及び7.80-8.05 [全8H, m, 7.92 (d, $J=8.4\text{Hz}$)]。

【1666】実施例779の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35-1.86, 1.86-2.29, 2.40-2.63, 2.63-3.16, 3.32-3.52及び4.85-5.08 [全11H, m, 2.52 (s), 2.57 (s)], 6.56-6.68及び6.82-7.56 (6H, m), 8.86及び8.97 (全2H, 各s), 9.17及び9.23 (全1H, 各s)。

【1667】実施例780の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.38-1.66, 1.85-2.22, 2.62-3.16及び4.90-5.15 (8H, m), 3.71 (3H, s), 6.58-6.70 (1H, m), 6.70-6.82 (1H, m), 6.82-7.00 (2H, m), 7.12-7.31 (2H, m), 7.50-7.80 (3H, m), 7.60-7.70 (1H, m)。

【1668】実施例781の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35-2.20, 2.65-3.15及び4.92-5.13 (全8H, m), 3.67 (3H, s), 6.55-6.84 (2H, m), 6.84-7.00 (2H, m), 7.00-7.19 (1H, m), 7.19-7.34 (2H, m), 7.73-7.85 (1H, m), 8.48-8.60 (1H, m), 8.60-8.72 (1H, m)。

【1669】実施例783の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.19-4.68及び5.00-5.19 [全27H, m, 2.36 (s), 3.75 (s)], 6.48-7.59 (7H, m)。

【1670】実施例784の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.05-2.21, 2.55-3.19, 3.41-3.55, 3.65-3.80, 3.95-4.23及び4.89-5.12 [全31H, m, 1.45 (s), 3.73 (s)], 6.51-6.74, 6.82-6.95, 7.19-7.35及び7.80-7.90 [全7H, m, 7.84 (d, $J=8.4\text{Hz}$)]。

【1671】実施例785の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.0-4.0及び4.0-5.2 (全29H, m), 6.1-8.2 (全11H, m)。

【1672】実施例786の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.0-1.4, 1.4-4.0及び4.0-5.2 (全33H, m), 6.15-6.35及び6.6-8.25 (全7H, m), 12.4-13.4 (1H, m)。

【1673】実施例787の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.2-1.6, 1.6-2.2, 2.6-3.75及び3.9-4.6 (全28H, m), 6.5-7.6及び7.8-8.2 (全12H, m), 10.8-11.2 (1H, m)。

【1674】実施例788の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (250MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.25-4.0, 4.35-4.55及び5.0-5.20 [全30H, m, 2.33 (s), 2.82 (s), 3.63 (s)], 6.55-7.55 [全6H, m, 6.6 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 6.96 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.20 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.49 (s)]。

【1675】実施例789の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.4-1.4, 1.4-2.4, 2.4-2.85, 2.85-3.3, 3.3-5.0及び5.0-5.8

(全29H, m), 6.29及び6.5-7.5 [全6H, m, 6.29 (d, J=8.4Hz)]。

【1676】実施例790の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.35-1.69, 1.78-2.26, 2.53-3.14, 3.30-3.81, 4.29-4.51及び4.90-5.18 [全15H, m, 2.98 (t, J=5.3Hz), 4.39 (t, J=5.3Hz), 3.72 (s)], 6.45-7.35, 7.65-7.92及び8.40-8.65 (全11H, m)。

【1677】実施例792の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0.75-0.98, 1.21-2.20, 2.42-4.19及び4.85-5.19 [全25H, m, 2.60 (s), 3.73 (s)], 6.45-6.75及び6.80-7.00 (全5H, m), 7.23 (1H, d, J=2.4Hz), 7.81 (1H, d, J=6.6Hz)]。

【1678】実施例794の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.11-3.95, 4.41-4.63及び4.95-5.15 [全28H, m, 1.49 (s), 1.58 (s), 2.38 (s)], 6.75-7.92 (7H, m)。

【1679】実施例795の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.11-4.05, 4.45-4.70及び4.81-5.13 [全27H, m, 2.40 (s), 1.25 (d, J=6.2Hz), 1.31 (d, J=6.3Hz)], 6.60-7.82 (8H, m)。

【1680】実施例796の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.35-2.18, 2.18-4.20, 4.25-4.70及び4.90-5.15 [全24H, m, 3.85 (s)], 6.55-7.15, 7.15-7.60及び7.70-8.10 (全21H, m)。

【1681】実施例797の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.03-1.40, 1.50-2.23, 2.23-2.58, 2.58-4.05, 4.05-4.30及び4.52-4.73 [全24H, m, 1.60 (s), 2.13 (s)], 6.55-7.05及び7.05-7.50 (全20H, m)。

【1682】実施例798の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.30-2.20, 2.62-3.18及び4.85-5.05 (全8H, m), 3.68 (3H, br s), 6.67-6.90及び7.00-7.50 (全7H, m), 7.75-7.85 (1H, m), 8.50-8.65 (1H, m), 8.65-8.85 (1

H, m)。

【1683】実施例799の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.30-1.80, 1.80-2.20, 2.62-2.93, 2.93-3.20及び4.82-5.03 (全8H, m), 3.71 (3H, s), 6.67-6.85 (2H, m), 7.10-7.48 (5H, m), 7.60-7.80 (2H, m), 8.60-8.70 (1H, m)。

【1684】実施例800の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1.33-1.65, 1.80-2.20, 2.62-2.70, 2.95-3.20, 3.50-3.90及び4.85-5.02 [全11H, m, 3.74 (s)], 5.02-6.00 (1H, br), 6.65-7.05 (3H, m), 7.05-7.50 (3H, m), 7.72-7.92 (2H, m), 8.68-8.83 (2H, m)。

【1685】実施例801の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm:
1.03-2.04 (10H, m), 2.31-3.88, 4.29-4.54及び4.84-5.07 [全19H, m, 2.43 (s), 3.77 (s)], 6.50-7.78 (11H, m), 8.44-8.69 (1H, m), 9.91-10.27 (1H, m)。

【1686】実施例802の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm:
1.05-2.36 (全10H, m, 1.18 (t, J=7.0Hz), 2.48-4.54及び4.79-5.21 [全19H, m, 3.60 (s)], 6.67-7.62 (11H, m), 10.04-10.39 (1H, m)。

【1687】実施例803の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm:
1.05-2.10 (10H, m), 2.39-3.94, 4.18-4.49及び4.88-5.12 [全16H, m, 3.58 (s)], 6.69-7.70 (11H, m), 8.34-8.71 (1H, m), 10.00-10.34 (1H, m)。

【1688】実施例804の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm:
1.00-2.28 [10H, m, 1.23 (t, J=7.2Hz)], 2.42-4.13, 4.26-4.52及び4.69-4.91 (全19H, m), 6.76-7.85 (11H, m), 10.09-10.48及び11.10-11.26 (全1H, m)。

【1689】実施例805の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO-d_6) δ ppm:
0.99-2.06 [10H, m, 1.20 (t, J=7.0Hz)], 2.38-4.08, 4.25-

4. 52及び4. 72-4. 92 (全16H, m), 6. 78-7. 84 (11H, m), 8. 43-8. 68 (1H, m), 10. 09-10. 45 (1H, m)。

【1690】実施例806の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1. 03-2. 11 (4H, m), 2. 34 (3H, s), 2. 44-4. 79及び4. 88-5. 10 (全16H, m), 6. 12-8. 03 (11H, m), 11. 08-11. 55 (1H, m)。

【1691】実施例807の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1. 03-2. 13 (10H, m), 2. 22-3. 83, 4. 17-4. 48及び4. 88-5. 10 [全16H, m, 2. 35 (s)], 6. 58-7. 90 (11H, m), 8. 39-8. 81 (1H, m), 10. 20-10. 65 (1H, m)。

【1692】実施例808の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1. 10-2. 28 (4H, m), 2. 52-4. 68及び4. 87-5. 10 [全22H, m, 3. 51 (s), 3. 65 (s)], 6. 11-6. 29及び6. 42-7. 65 (全10H, m), 11. 07-11. 48 (1H, brs)。

【1693】実施例809の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 0. 95-2. 26 (10H, m), 2. 38-4. 08, 4. 20-4. 52及び4. 78-5. 08 [全19H, m, 3. 58 (s), 3. 75 (s)], 6. 62-7. 62 (10H, m), 8. 36-8. 68 (1H, m), 9. 82-10. 20 (1H, m)。

【1694】実施例810の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1. 07-2. 29 (4H, m), 2. 30-4. 78及び4. 87-5. 10 [全22H, m, 3. 51 (s), 3. 65 (s)], 6. 11-6. 29及び6. 42-7. 63 (全10H, m), 11. 13-11. 58 (1H, brs)。

【1695】実施例811の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1. 03-2. 30 (10H, m), 2. 40-4. 00, 4. 18-4. 76及び4. 83-5. 08 [全19H, m, 3. 58 (s), 3. 75 (s)], 6. 63-7. 64 (10H, m), 8. 34-8. 71 (1H, m), 9. 92-10. 39 (1H, m)。

【1696】実施例812の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1. 05-2. 09 (4H, m), 2. 30 (3H, m), 2. 58-4. 71及び4. 88-5. 18 [全19H, m, 3. 57 (s)], 6. 12-7. 6

8 (10H, m), 11. 00-11. 50 (1H, brs)。

【1697】実施例813の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 0. 96-2. 19 [10H, m, 1. 19 (t, $J=7. 0\text{Hz}$)], 2. 31 (3H, s), 2. 55-4. 69及び4. 82-5. 08 [全19H, m, 3. 59 (s)], 6. 12-7. 63 (10H, m), 10. 19-10. 52及び11. 00-11. 30 (全1H, m)。

【1698】実施例814の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 30, 2. 50-3. 85, 4. 48-4. 67及び5. 06-5. 24 [全15H, m, 2. 56 (s) 及び3. 72 (s)], 6. 50-6. 72 (1H, m), 6. 72-7. 95 (9H, m), 8. 57-8. 75 (1H, m)。

【1699】実施例816の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 21 (4H, m), 2. 33-2. 55, 3. 09-3. 87及び4. 39-4. 62 [全11H, m, 2. 45及び3. 69 (各s)], 2. 60-3. 05 (2H, m), 4. 81-5. 19 [2H, m, 4. 93及び5. 09 (各s)], 6. 25-7. 53 (12H, m)。

【1700】実施例817の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 15-2. 19 (4H, m), 2. 44及び2. 47 (全3H, 各s), 2. 11-3. 08 (2H, m), 3. 08-3. 90, 4. 39-4. 62及び4. 79-5. 31 [全7H, 4. 89及び5. 06 (全2H, 各s)], 6. 25-7. 52 (12H, m)。

【1701】実施例818の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 12-2. 17 [全10H, m, 1. 24及び1. 35 (各d, $J=6. 0\text{Hz}$)], 2. 32-2. 59 [3H, m, 2. 43 (s)], 2. 61-3. 32 (3H, m), 3. 41-3. 92 [6H, m, 3. 70 (s)], 4. 29-4. 63及び5. 01-5. 22 (全2H, m), 6. 18-7. 42 (7H, m)。

【1702】実施例819の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1. 09-2. 22 [10H, m, 1. 22及び1. 35 (各d, $J=6. 0\text{Hz}$)], 2. 30-2. 58 [3H, m, 2. 43及び2. 47 (各s)], 2. 11-4. 01 (4H, m), 4. 28-4. 70及び4. 99-5. 22 (全2H, m), 6. 13-7. 48 (8H, m)。

【1703】実施例820の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.75–1.00, 1.00–2.20, 2.60–3.05, 3.05–3.43, 3.43–3.96 及び 4.45–4.62 [全24H, m, 1.59 (s), 3.19 (s) 及び 3.69 (s)], 6.80–7.50 (7H, m)。

【1704】実施例821の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.70–1.00, 1.10–2.20, 2.60–3.95, 4.45–4.65 及び 5.02–5.15 (全21H, m), 6.80–7.55 (7H, m)。

【1705】実施例822の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.60–1.05, 1.15–2.20, 2.60–3.05, 3.15–3.95, 4.45–4.60 及び 5.02–5.15 (全30H, m), 6.72–7.60 (7H, m)。

【1706】実施例823の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.63–1.00, 1.10–2.20, 2.60–3.95, 4.45–4.60 及び 5.00–5.20 (全27H, m), 6.68–7.58 (7H, m)。

【1707】実施例825の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.20–2.20, 2.35–2.60, 2.60–3.85 及び 4.25–4.65 (全16H, m), 6.40–6.66 (1H, m), 6.70–7.55 (11H, m)。

【1708】実施例826の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.20–2.25, 2.25–3.26, 3.26–3.90 及び 4.50–4.70 [全12H, m, 2.61 (s)], 6.72–6.85 (1H, m), 6.85–6.97 (1H, m), 7.00–7.35 (3H, m), 7.35–7.45 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.56–7.78 (2H, m), 7.85–8.12 (2H, m), 8.20–8.38 (1H, m), 8.70–8.80 (1H, m)。

【1709】実施例827の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.2–2.4 (4H, m), 2.7–3.8, 4.4–4.7 及び 4.9–5.2 (全5H, 各m), 6.8–8.4 (7H, m)。

【1710】実施例828の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.13–2.30 (4H, m), 2.35–4.08, 4.40–4.64 及び 4.92–5.20 [全13H, m, 2.52 (s), 3.72 (s), 5.08 (s)], 6.48–7.62 (16H, m)。

【1711】実施例829の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.13–2.26, 2.32–3.69 及び 4.81–5.20 [全13H, m, 2.49 (s), 5.07 (s)], 6.57–7.63 (16H, m)。

【1712】実施例833の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.86, 0.93, 1.07, 1.15–2.15, 2.60–3.80 及び 4.35–4.60 [全23H, m, 0.86 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 0.93 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.07 (t, $J=7\text{Hz}$)], 6.75–7.60 [全7H, m], 8.25–8.80 (1H, m)。

【1713】実施例834の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.20–2.15, 2.55–3.85, 4.35–4.55 及び 4.67 [全15H, m, 4.67 (s)], 6.70–7.40, 7.44 及び 7.50–7.90 [全12H, m, 7.44 (s)]。

【1714】実施例835の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.35–2.24, 2.39–2.62, 2.63–3.18, 3.29–3.99, 4.06–4.63 及び 4.83–5.11 [全15H, m, 2.49 (s), 3.81 (t, $J=6.0\text{Hz}$)], 6.58–7.62 (11H, m)。

【1715】実施例836の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.67–1.03, 1.05–2.54, 2.55–4.28, 4.41–4.63 及び 5.00–5.21 [全24H, m, 0.78 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 0.92 (d, $J=6.6\text{Hz}$), 2.28 (d, $J=7.2\text{Hz}$), 2.43 (s), 3.71 (s)], 6.40–7.41 (7H, m)。

【1716】実施例838の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.96 及び 1.04 (全6H, 各d, $J=6.7\text{Hz}$), 1.18–2.20 (4H, m), 2.44 及び 2.48 (全3H, 各s), 2.61–3.31, 3.39–4.16 及び 5.02–5.27 (全8H, m), 6.19–7.42 (8H, m)。

【1717】実施例839の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.92 及び 0.99 (全3H, 各t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.15–2.22 (8H, m), 2.43 及び 2.47 (全3H, 各s), 2.62–3.31, 3.36–4.09, 4.38–4.65 及び 5.01–5.23 [全7H, m, (3.82 及び 3.97 (各t, $J=6.5\text{Hz}$), 6.17–7.41 (8H, m)。

【1718】実施例840の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
0.65–0.98, 1.04–2.12, 2.13–3.70, 4.26–4.51及び4.81–5.02 [全21H, m, 0.75 (d, $J=6.5\text{Hz}$), 0.89 (d, $J=6.5\text{Hz}$), 2.27 (d, $J=7.1\text{Hz}$), 2.33 (s)], 6.38–7.42 (7H, m), 12.14–12.42 (1H, m)。

【1719】実施例841の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.85–2.22, 2.55–3.31, 3.41–3.80, 4.05–4.31及び4.41–4.62 [全25H, m, 3.69 (s)], 6.71–7.70 (7H, m)。

【1720】実施例842の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.82–1.03, 1.15–2.20及び2.45–4.62 [全22H, m, 0.93 (s)], 6.48–8.21 (8H, m)。

【1721】実施例843の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.10–2.41, 2.56–4.65及び4.90–5.16 (全15H, m), 6.52–7.69 (7H, m), 9.39–10.05 (1H, m)。

【1722】実施例844の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.13–4.01及び4.48–4.72 [全23H, m, 2.33 (s)], 5.10 (2H, d, $J=10.3\text{Hz}$), 6.43–7.64 (16H, m)。

【1723】実施例845の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.09–4.20, 4.50–4.70及び4.96–5.16 [全23H, m, 2.36 (s)], 6.41–7.48 (12H, m)。

【1724】実施例849の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.2–2.2 (4.5H, m), 2.7–3.0 [全5H, m, 2.83 (s)], 3.1–3.3, 3.3–3.5, 3.6–3.85, 4.35–4.5及び5.05–5.35 [全12.5H, m, 3.40 (t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.67 (s), 3.77 (s)], 6.62 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.82 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.9–7.4 (4H, m)。

【1725】実施例850の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
0.95 (6H, d, $J=6.2\text{Hz}$), 1.25–2.15, 2.7–3.3, 3.67, 3.72, 4.35–4.65及び5.10–5.4 [全19H, m, 3.67 (s), 3.72 (s)], 6.26, 6.6

4, 6.73–6.78, 6.96及び7.12–7.4 [全6H, m, 6.26 (d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.64 (d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.96 (dd, $J=8.1\text{Hz}$, 2.2Hz)]。

【1726】実施例851の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.2–2.2, 2.7–3.05, 3.15–3.3, 3.4–4.0, 4.4–4.55, 4.6–4.8及び5.05–5.25 [全20H, m, 3.69 (s), 3.71 (s)], 6.60–7.45 [全6H, m, 6.63 (d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.85 (d, $J=8.1\text{Hz}$)]。

【1727】実施例852の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.17–2.30 (4H, m), 2.57–3.03, 3.09–3.33, 3.43–3.92, 4.38–4.63及び5.08–5.28 [全10H, m, 3.62 (s), 3.70 (s)], 6.53–7.43 (10H, m)。

【1728】実施例853の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.18–2.30 (4H, m), 2.60–3.05, 3.10–3.37, 3.46–4.33, 4.38–4.62及び5.08–5.29 [全10H, m, 3.67 (s), 3.71 (s), 3.81 (s)], 6.52–7.46 (10H, m)。

【1729】実施例854の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.19–2.46 [7H, m, 2.37 (s)], 2.58–3.04, 3.05–4.26, 4.38–4.63及び5.06–5.28 [全11H, m, 3.67 (s), 3.71 (s)], 6.54–7.48 (10H, m)。

【1730】実施例855の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , CDCl_3) δ ppm:
1.20–2.28 (4H, m), 2.39 (3H, s), 2.57–3.10, 3.11–4.35, 4.40–4.63及び5.08–5.30 [全8H, m, 3.75 (s)], 6.47–6.71及び6.81–7.78 (全11H, m)。

【1731】実施例856の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1.12–2.19 (4H, m), 2.57–4.08, 4.20–4.66及び4.81–5.08 [全11H, m, 3.52 (s), 3.65 (s)], 6.62–7.62 (10H, m), 12.36 (1H, s)。

【1732】実施例857の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz , $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:
1.10–2.19 (4H, m), 2.43–4.

14, 4.20-4.71及び4.83-5.10 [全11H, m, 3.59 (s), 3.75 (s)], 6.67-7.65 (10H, m), 12.20-12.57 (1H, brs)。

【1733】実施例858の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1.13-2.38 [7H, m, 2.31 (s)], 2.51-4.02, 4.19-4.75及び4.82-5.08 [全8H, m, 3.59 (s)], 6.62-7.80 (10H, m), 12.20-12.58 (1H, brs)。

【1734】実施例859の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1.18-2.18 (4H, m), 2.34 (3H, s), 2.48-4.12, 4.20-4.80及び4.89-5.12 (全5H, m), 6.61-7.88 (11H, m), 12.12-12.60 (1H, m)。

【1735】実施例860の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.15-2.25, 2.50-3.03, 3.10-3.30, 3.48-3.91, 4.25-4.55及び5.05-5.28 [全19H, m, 3.71 (s), 3.74 (s), 4.40 (t, $J=5.9\text{Hz}$)], 6.42-7.42及び7.71-7.99 [全7H, m, 6.58 (d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.86 (d, $J=8.3\text{Hz}$)]。

【1736】実施例861の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.75-2.21, 2.51-3.31, 3.45-4.10, 4.30-4.60及び5.03-5.31 [全24H, m, 0.95 (d, $J=6.7\text{Hz}$), 3.92 (d, $J=7.2\text{Hz}$), 3.72 (s), 3.74 (s)], 6.42-7.41及び7.65-8.00 [全7H, m, 6.58 (d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.88 (d, $J=8.3\text{Hz}$)]。

【1737】実施例862の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.11-2.31, 2.51-3.32, 3.42-4.09, 4.30-4.58及び5.05-5.21 [全19H, m, 3.79 (s), 4.44 (t, $J=7.8\text{Hz}$)], 6.49-7.42 [6H, m, 6.62 (d, $J=8.3\text{Hz}$)]。

【1738】実施例863の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 0.88 (6H, d, $J=6.7\text{Hz}$), 1.10-2.07, 2.52-4.45及び4.85-5.02 [全15H, m, 3.63 (s), 3.98 (d, $J=7.2\text{Hz}$)], 6.50-6.88, 6.98-7.29, 7.38-7.79及び8.28-8.49 [全

7H, m, 6.70 (d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.52 (d, $J=8.3\text{Hz}$)]。

【1739】実施例864の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 1.01-2.10, 2.39-4.51及び4.86-5.05 [全13H, m, 3.67 (s)], 6.0-7.75 (6H, m), 9.99 (1H, s)。

【1740】実施例865の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.11-2.21, 2.60-3.29, 3.41-3.90, 4.41-4.65及び4.82-5.20 [全19H, m, 1.26 (d, $J=6.4\text{Hz}$), 3.69 (s)], 6.53-7.80 [全8H, m, 6.71 (s), 7.46 (s)]。

【1741】実施例866の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.85-2.18, 2.45-3.90, 4.29-4.60及び4.78-5.18 [全16H, m, 1.28 (d, $J=7.2\text{Hz}$)], 6.40-7.81 (8H, m), 7.90-9.60 (1H, m)。

【1742】実施例867の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.11-2.29, 2.68-3.92, 4.38-4.70及び5.01-5.19 [全20H, m, 1.50 (s), 1.58 (s), 2.16 (s), 3.70 (s)], 6.78-7.90 [全7H, m, 7.59 (d, $J=2.1\text{Hz}$)]。

【1743】実施例868の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.06-2.69, 2.98-4.26及び4.60-4.81 [全33H, m, 2.32 (s), 2.39 (s)], 6.42-7.45 (7H, m)。

【1744】実施例869の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.68-2.72, 3.01-4.25及び4.65-4.92 [全25H, m, 2.32 (s), 2.47 (s), 3.82 (s)], 6.46-7.12 (11H, m)。

【1745】実施例870の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.93-2.98, 3.29-4.59及び4.69-5.31 [全23H, m, 2.35 (s), 3.60 (t, $J=5.5\text{Hz}$), 4.35 (t, $J=5.3\text{Hz}$), 6.69-7.70 (7H, m)。

【1746】実施例871の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.16-2.98, 3.42-3.91, 4.02-4.25, 4.60-4.88及び5.02-5.40 [全19H, m, 2.35 (s), 4.79 (s)],

6. 61-7. 05及び7. 13-7. 94 (全12 H, m)。

【1747】(11H, m)。

【1748】実施例873の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
0. 80-2. 61, 2. 88-3. 72, 3. 85-4. 40及び4. 62-5. 01 [全27H, m, 1. 31 (t, $J=7. 0\text{Hz}$), 2. 35 (s), 4. 22 (q, $J=7. 1\text{Hz}$)], 6. 41-7. 49 (7 H, m)。

【1749】実施例874の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 18-1. 48, 1. 68-2. 62, 2. 95-4. 41及び4. 71-5. 05 [全19H, m, 1. 31 (t, $J=7. 1\text{Hz}$), 2. 50 (s), 3. 80 (s), 4. 22 (q, $J=6. 8\text{Hz}$)], 6. 45-7. 65 (全11H, m)。

【1750】実施例875の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 10-2. 62, 2. 90-3. 70, 3. 85-4. 21及び4. 65-4. 95 [全22H, m, 2. 35 (s)], 6. 35-7. 45 (7H, m)。

【1751】実施例876の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 69-2. 62, 2. 81-4. 28及び4. 65-4. 98 [全14H, m, 2. 43 (s), 3. 80 (s)], 6. 41-7. 62 [11H, m, 7. 38 (d, $J=9. 2\text{Hz}$)]。

【1752】実施例877の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 53 (9H, s), 1. 71-2. 24, 2. 50-2. 91, 3. 49-4. 45及び4. 61-5. 10 [全12H, m, 3. 59 (t, $J=6. 3\text{Hz}$), 4. 28 (t, $J=6. 0\text{Hz}$)], 6. 65-7. 80及び8. 55-8. 68 (全8H, m)。

【1753】実施例878の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
1. 53 (9H, s), 2. 09-2. 31, 2. 52-2. 82, 3. 55-4. 51及び4. 62-5. 09 [全12H, m, 2. 17 (t, $J=5. 1\text{Hz}$), 4. 37 (t, $J=5. 5\text{Hz}$)], 6. 89-7. 71 (7H, m)。

【1754】実施例879の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ ppm:
2. 05-2. 90及び3. 46-5. 10 [全12 H, m, 3. 60 (t, $J=5. 8\text{Hz}$), 4. 38 (t, $J=5. 3\text{Hz}$)], 6. 81-7. 71 (7 H, m), 10. 1-10. 6 (1H, m)。

【1755】実施例880の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ p p

m: 2. 51-2. 88及び3. 10-5. 15 [全6 H, m, 4. 94 (s)], 6. 70-7. 35, 7. 45-7. 85, 7. 92-8. 28及び8. 55-8. 65 (全13H, m)。

【1756】実施例881の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ p p m:
1. 12-1. 41, 2. 51-2. 86, 3. 69-4. 01, 4. 10-4. 48及び4. 62-4. 98 [全13H, m, 1. 29 (t, $J=4. 0\text{Hz}$), 4. 69 (s)], 6. 65-7. 10及び7. 19-7. 92 [全12H, m, 7. 73 (d, $J=8. 8\text{Hz}$), 7. 84 (d, $J=7. 0\text{Hz}$)]。

【1757】実施例882の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ p p m:
2. 30-2. 76, 3. 56-3. 96及び4. 27-4. 80 (全4H, m), 4. 94 (2H, s), 6. 71-7. 90 (8H, m)。

【1758】実施例883の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ p p m:
1. 60-2. 09, 2. 28-4. 32及び4. 60-5. 10 (全10H, m), 6. 41-8. 25及び8. 41-8. 90 [全13H, m, 8. 12 (d, $J=7. 4\text{Hz}$)]。

【1759】実施例884の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ p p m:
1. 05-1. 49及び2. 25-4. 99 [全15 H, m, 1. 31 (t, $J=7. 1\text{Hz}$)], 6. 60-7. 90及び8. 00-8. 28 [全12H, m, 8. 12 (d, $J=7. 7\text{Hz}$)]。

【1760】実施例885の化合物

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ p p m:
0. 85-4. 70及び4. 88-6. 20 (全11 H, m), 6. 51-8. 62 [全12H, m, 7. 94 (d, $J=7. 2\text{Hz}$)]。

【1761】<薬理試験例>

試験1) V_1 リセプター バインディング アッセイ (V_1 receptor binding assay)

イチハラ (Akira Ichihara) の方法 [J. Bio. Chem., 258, 9283 (1983)] に準じて調製したラット肝臓の膜標本を用いて、 $[^3\text{H}]$ -Arg-バソプレシン (vasopressin) の50000 dpm ($2 \times 10^{-10}\text{M}$) 膜標本60 μg 試験薬 ($10^{-8} \sim 10^{-4}\text{M}$) を、5mM MgCl_2 、1mM EDTA及び0. 1% BSAを含む100mM トリス-塩酸緩衝液 (pH=8. 0) の総量250 μl 中で10分間、37℃でインキュベーションした。その後、ガラスフィルター (GF/F) を用いて、バソプレシンと結合した膜標本を分離するために濾過を3回行ない緩衝液5mlにて洗浄した。このガラスフィ

ルターを取り出し、液体シンチレーション用カクテルと混合し、液体シンチレーションカウンターにて膜と結合した $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシン量を測定し、阻害率を次式により算出した。

$$\text{【1762】 阻害率 (\%) = } 100 - \left[\frac{(C_1 - B_1)}{(C_0 - B_1)} \right] \times 100$$

C_1 ; 既知量の供試薬剤と $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンとの共存下での $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンの膜に対する結合量

C_0 ; 供試薬剤を除いた時の $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンの膜に対する結合量

B_1 ; 過剰のバソプレシン (10^{-6}M) 存在下での $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンの膜に対する結合量

上記で算出された阻害率が50%となる供試薬剤の濃度を求め、これを IC_{50} 値とした。結果を下記表に示す。

【1763】試験2) V_2 リセプター バインディング アッセイ (V_2 receptor binding assay)

O. HECHTERの方法 [J. Bio. Chem., 253, 3211 (1978)] に準じて調製したラット腎臓の膜標本を用いて、 $^{[3]}\text{H}$ -Arg-バソプレシン (vasopressin) の 100000dpm ($4 \times 10^{-10}\text{M}$) 膜標本0.6mg試験薬 (10^{-10}

$\sim 10^{-5}\text{M}$) を、5mM MgCl_2 、1mM EDTA及び0.1%BSAを含む 100mM トリス-塩酸緩衝液 ($\text{pH}=8.0$) の総量 $250\mu\text{l}$ 中で3時間、 4°C でインキュベーションした。その後、ガラスフィルター (GF/F) を用いて、バソプレシンと結合した膜標本を分離するために濾過を行ない2回緩衝液 5ml にて洗浄した。このガラスフィルターを取出し、液体シンチレーション用カクテルと混合し、液体シンチレーションカウンターにて膜と結合した $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシン量を測定し、阻害率を次式により算出した。

$$\text{【1764】 阻害率 (\%) = } 100 - \left[\frac{(C_1 - B_1)}{(C_0 - B_1)} \right] \times 100$$

C_1 ; 既知量の供試薬剤と $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンとの共存下での $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンの膜に対する結合量

C_0 ; 供試薬剤を除いた時の $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンの膜に対する結合量

B_1 ; 過剰のバソプレシン (10^{-6}M) 存在下での $^{[3]}\text{H}$ -バソプレシンの膜に対する結合量

上記で算出された阻害率が50%となる供試薬剤の濃度を求め、これを IC_{50} 値とした。結果を下記表に示す。

【1765】

【表492】

供試化合物	V_1 ($\text{IC}_{50}\mu\text{M}$)	V_2 ($\text{IC}_{50}\mu\text{M}$)
実施例29の化合物	0.021	0.15

【1766】試験3) *in vivo*における抗バソプレッサー作用

覚醒下で供試化合物の経口投与による抗バソプレッサー作用を調べるために、ペントバルビタール麻酔下にSD系雄性ラット (体重 $300 \sim 450\text{g}$) の腹部大動脈及び頸動脈にカニューレを挿入した。手術後2~3日の回復期の後、血圧は腹部大動脈のカニューレより圧トランスデューサを用い、覚醒下に測定し、バソプレシンは頸動脈より投与した。供試化合物は、ポリエチレングリコール400や水に溶解もしくは5%アラビアゴム溶液に懸濁させた状態で経口投与した。

【1767】供試化合物投与前のバソプレシン $30\text{mU}/\text{kg}$ 静脈内投与による拡張期血圧の上昇を100%とし、供試化合物投与後は30分間隔で投与後8時間まで、バソプレシン $30\text{mU}/\text{kg}$ 静脈内投与による拡張期血圧の上昇を測定し、供試化合物による血圧上昇の抑制率をもって供試化合物の抗バソプレッサー作用とした。

【1768】効果用量 ID_{50} 値は、バソプレシン $30\text{mU}/\text{kg}$ 静脈内投与による拡張期血圧の上昇を50%抑制する時の、供試化合物の経口投与量として求めた。

【1769】実施例29及び実施例70の化合物は、それぞれ $1.0\text{mg}/\text{kg}$ 、 $2.8\text{mg}/\text{kg}$ の ED_{50} 値

を示した。

【1770】試験4) 抗-抗利尿作用 (内因性ADHに対する作用)

無処置、無拘束下のラット (SD系、雄、体重 $300 \sim 350\text{g}$) に、供試化合物及び溶媒 (ジメチルホルムアミド) を経口投与し、2時間の間に自発的に排出された尿を代謝ゲージにて集めた。この間、水及び餌は自由に摂取させた。

【1771】実施例493の化合物を $10\text{mg}/\text{kg}$ 経口投与することにより、投与直後から2時間までの尿量は、溶媒投与群に比して、4倍に増加した。

【1772】試験5) 抗利尿作用

無処置、無拘束下の遺伝的にバソプレシンが欠如したラット (Brattleboroラット) に、供試化合物をポリエチレングリコール400や水に溶解もしくは5%アラビアゴム溶液に懸濁させた状態で強制的に経口投与した。投与後代謝ゲージにて、自発的に排出された尿を2時間間隔にて採取した。この間、水及び餌は自由に摂取させた。

【1773】実施例562の化合物を $1\text{mg}/\text{kg}$ 経口投与することにより、投与直後から2時間までの尿量は、溶媒投与群に比して、1/5に減少した。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D	401/06	2 2 3	C 0 7 D	401/06 2 2 3
	401/10	2 4 3		401/10 2 4 3
	401/12	2 2 3		401/12 2 2 3
	401/14	2 2 3		401/14 2 2 3
	403/10	2 0 9		403/10 2 0 9
		2 2 3		2 2 3
	403/12	2 2 3		403/12 2 2 3
	405/12	2 2 3		405/12 2 2 3
	409/06	2 2 3		409/06 2 2 3
	413/10	2 2 3		413/10 2 2 3
		2 4 3		2 4 3
	417/06	2 2 3		417/06 2 2 3
	417/10	2 2 3		417/10 2 2 3
	471/04	1 0 8		471/04 1 0 8 A
(72) 発明者	菅 慶三		(72) 発明者	棚田 喜久
	徳島県徳島市川内町金岡 5 番 2			徳島県鳴門市撫養町齊田字東発19番 3
(72) 発明者	松崎 敬之		(72) 発明者	栗村 宗明
	徳島県徳島市南島田町 2 丁目89番地105号			徳島県鳴門市撫養町小桑島字前浜252番地
(72) 発明者	篠原 友一			鳴門グランドハイツ503号室
	徳島県鳴門市撫養町小桑島字前浜140番地		(72) 発明者	富永 道明
	サンヴィレッジ605号室			徳島県板野郡上板町高磯310番地の 6
			(72) 発明者	藪内 洋一
				徳島県徳島市川内町大松900番地の25